



DEUTSCHES
PATENTAMT

⑳ Aktenzeichen: P 44 24 787.7
㉔ Anmeldetag: 14. 7. 94
㉕ Offenlegungstag: 18. 1. 96

㉑ Int. Cl. 6:
C 07 D 285/135
C 07 D 417/12
C 07 D 265/36
C 07 D 277/68
C 07 D 271/113
C 07 D 249/14
C 07 D 413/12
C 07 D 401/12
C 07 D 403/12
A 01 N 43/82

DE 44 24 787 A 1

REFERENCE AE

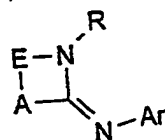
// C07D 521/00 (C07D 417/12, 285:135, 265:36, 277:68, 209:34, 215:227, 241:44) C07C 323/25, 323/52

㉑ Anmelder:
Bayer AG, 51373 Leverkusen, DE

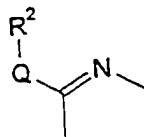
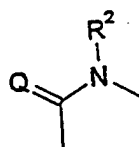
㉒ Erfinder:
Schallner, Otto, Dr., 40789 Monheim, DE; Lender,
Andreas, Dr., 22339 Hamburg, DE; Santel,
Hans-Joachim, Dr., 51371 Leverkusen, DE; Dollinger,
Markus, Dr. agr., 51381 Leverkusen, DE

㉓ Substituierte Aryliminoheterocyclen

㉔ Die Erfindung betrifft neue substituierte Aryliminoheterocyclen der allgemeinen Formel (I)



in welcher
A für Sauerstoff, Schwefel oder die Gruppierung N-R¹ steht,
wobei
R¹ für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls substitu-
iertes Alkyl, Alkenyl oder Alkynyl steht,
E für eine der nachstehenden Gruppierungen steht,



wobei
Q für Sauerstoff, Schwefel oder die Gruppierung N-R¹ steht
(wobei R¹ die oben angegebene Bedeutung hat) und
R² für Wasserstoff, Cyano oder für jeweils gegebenenfalls
substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl oder Cycloal-
kenyl steht,
R für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls substitu-
iertes Alkyl, Alkenyl oder Alkynyl steht, und
Ar für jeweils gegebenenfalls substituiertes, monocyclisches

oder bicyclisches Aryl oder Heteroaryl steht,
Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als
Herbizide.

DE 44 24 787 A 1

Die folgenden Angaben sind den vom Anmelder eingereichten Unterlagen entnommen
BUNDESDRUCKEREI 11. 95 508 063/289

① Aktenzeichen: P 44 24 787.7
② Anmeldetag: 14. 7. 94
③ Offenlegungstag: 18. 1. 96

REFEREN

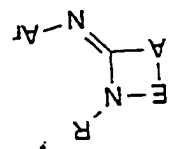
// C07D 521/00 (C07D 417/12, 285:135, 265:36, 277:68, 209:34, 215:227, 241:44) C07C

⑦ Erfinder:
Schallner, O.
Andreas, Dr.
Hans-Joachi
Markus, Dr. a

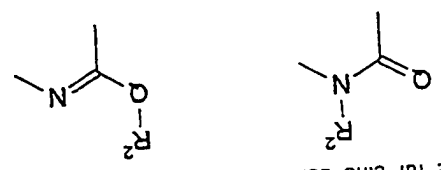
⑦ Anmelder:
Bayer AG, 51373 Leverkusen, DE

--	--

⑤4 Substituierte Aryliminoheterocyclen
⑤7 Die Erfindung betrifft neue substituierte Aryliminoheterocyclen der allgemeinen Formel (I)



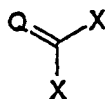
in welcher
A für Sauerstoff, Schwefel oder die Gruppierung N-R¹ steht,
wobei
R¹ für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls substituierbares Alkyl, Alkenyl oder Alkinyl steht,
E für eine der nachstehenden Gruppierungen steht,



DE 44 24 787 A 1

Die folgenden Angaben sind den vom Anmelder eingereichte

Ar für jeweils gegebenenfalls substituiertes, monocyclisches
R für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls substituierbares Alkyl, Alkenyl oder Alkinyl steht, und
substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cycloalkyl oder Cycloalkenyl steht,
R² für Wasserstoff, Cyano oder für jeweils gegebenenfalls (wobei R¹ die oben angegebene Bedeutung hat) und
Q für Sauerstoff, Schwefel oder die Gruppierung N-R¹ steht



(III)

5

in welcher

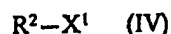
Q die oben angegebene Bedeutung hat und

X für Halogen, Alkoxy, Aryloxy oder Aralkoxy steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungs- 10

mittels cyclisiert

und gegebenenfalls die hierbei erhaltenen Verbindungen der Formeln (IA) und/oder (IB), für den Fall, daß darin

R² für Wasserstoff steht, mit Alkylierungsmitteln der allgemeinen Formel (IV)

15

in welcher

R² mit Ausnahme von Wasserstoff die oben angegebene Bedeutung hat undX¹ für Halogen oder die Gruppierung -O-SO₂-O-R² steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungs- 20

mittels umsetzt.

Die neuen substituierten Aryliminoheterocyclen der allgemeinen Formel (I) zeichnen sich durch starke herbi- zide Wirksamkeit aus.

In den Definitionen sind die gesättigten oder ungesättigten Kohlenwasserstoffketten, wie Alkyl, Alkenyl oder Alkynyl jeweils geradkettig oder verzweigt. 25

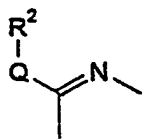
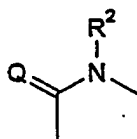
Halogen steht im allgemeinen für Fluor, Chlor, Brom oder Iod, vorzugsweise für Fluor, Chlor oder Brom, insbesondere für Fluor oder Chlor.

Gegenstand der Erfindung sind vorzugsweise Verbindungen der Formel (I), in welcher

A für Sauerstoff, Schwefel oder die Gruppierung N-R¹ steht, wobeiR¹ für Wasserstoff oder für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkyl-carbonyl oder 30C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen oder für jeweils gegebenenfalls

durch Halogen substituiertes Alkenyl oder Alkynyl mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,

E für eine der nachstehenden Gruppierungen steht, 35



35

40

wobei

Q für Sauerstoff, Schwefel oder die Gruppierung N-R¹ steht (wobei R¹ die oben als bevorzugt angegebene Bedeutung hat) undR² für Wasserstoff, Cyano oder für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkyl-carbo- 45nyl oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen oder für jeweils gegeb-

enenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyl oder Alkynyl mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen oder für

jeweils gegebenenfalls durch Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffato-

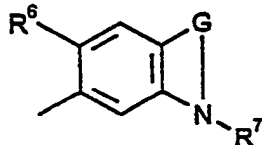
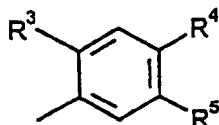
men oder Cycloalkenyl mit 5 oder 6 Kohlenstoffatomen steht,

R für Wasserstoff oder für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkyl-carbonyl oder 50C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen oder für jeweils gegebenenfalls

durch Halogen substituiertes Alkenyl oder Alkynyl mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen steht, und

Ar für eine der nachstehenden, jeweils gegebenenfalls substituierten, monocyclischen oder bicyclischen Aryl-

oder Heteroaryl-Gruppierungen steht, 55



60

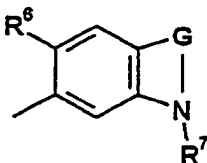
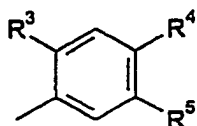
worin

R³ für Wasserstoff oder Halogen steht, 65R⁴ für Wasserstoff, Cyano, Nitro, Thiocarbamoyl, Halogen oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy steht,R⁵ für die nachstehende Gruppierung steht,

R² für Wasserstoff, Cyano oder für gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy, Acetyl, Propionyl, Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Propenyl, Butenyl, Propinyl oder Butinyl, oder für Cyclopentenyl oder Cyclohexenyl steht,

R für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, Acetyl, Propionyl, Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Propenyl, Butenyl, Propinyl oder Butinyl steht, und

Ar für eine der nachstehenden, jeweils gegebenenfalls substituierten, monocyclischen oder bicyclischen Aryl- oder Heteroaryl-Gruppierungen steht,



worin

R³ für Wasserstoff, Fluor oder Chlor steht.

R⁴ für Wasserstoff, Cyano, Chlor, Brom, Methyl oder Trifluormethyl steht.

R⁵ für die nachstehende Gruppierung steht,

$$-A^1 - A^2 - A^3$$

in welcher

A⁴ für eine Einfachbindung, für Sauerstoff, Schwefel, —SO—, —SO₂—, —CO— oder die Gruppierung —N—A⁴— steht, worin A⁴ für Wasserstoff, Hydroxy, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl steht, oder

A¹ weiterhin für Methylen, Ethan-1,1-diyl, Ethan-1,2-diyl, Propan-1,1-diyl, Propan-1,2-diyl, Propan-1,3-diyl, Ethan-1,2-diyl, Propen-1,2-diyl, Propen-1,3-diyl, Ethin-1,2-diyl oder Propin-1,3-diyl steht,

A² für eine Einfachbindung, für Sauerstoff, Schwefel, -SO-, -SO₂-, -CO- oder die Gruppierung -N-A⁴- steht, worin A⁴ für Wasserstoff, Hydroxy, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl oder Phenylsulfonyl steht, oder

A² weiterhin für Methylen, Ethan-1,1-diyl, Ethan-1,2-diyl, Propan-1,1-diyl, Propan-1,2-diyl, Propan-1,3-diyl, Ethen-1,2-diyl, Propen-1,2-diyl, Propen-1,3-diyl, Ethin-1,2-diyl oder Propin-1,3-diyl steht,

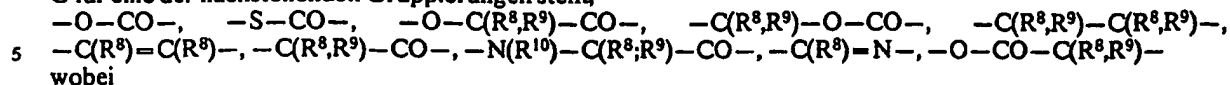
A³ für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, Cyano, Nitro, Carboxy, Carbamoyl, Sulfo, Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, n-, i-, s- oder t-Pentyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, n-, i-, s- oder t-Pentyloxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, n-, i-, s- oder t-Butylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Dimethoxyphosphoryl, Diethoxyphosphoryl oder Dipropoxyphosphoryl, Diisopropoxyphosphoryl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes Propenyl, Butenyl, Propenyloxy, Butenyloxy, Propenylamino, Butenylamino, Propylidenamino, Butylidenamino, Propenyloxy-carbonyl, Butenyloxy-carbonyl, Propinyl, Butinyl, Propinyloxy, Butinyloxy, Propinylamino, Butinylamino, Propinyloxy-carbonyl oder Butinyloxy-carbonyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Cyano, Carboxy, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopropyloxy, Cyclobutyloxy, Cyclopentyloxy, Cyclohexyloxy, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl, Cyclohexylmethyl, Cyclopropylmethoxy, Cyclobutylmethoxy, Cyclopentylmethoxy, Cyclohexylmethoxy, Cyclopentylidenamino, Cyclohexylidenamino, Cyclopentylloxycarbonyl, Cyclohexylloxycarbonyl, Cyclopentylmethoxycarbonyl oder Cyclohexylmethoxycarbonyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Carboxy, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Methoxycarbonyl und/oder Ethoxycarbonyl substituiertes Phenyl, Phenylloxy, Benzyl, Phenylethyl, Benzyloxy, Phenylloxycarbonyl, Benzyloxycarbonyl, (jeweils gegebenenfalls ganz oder teilweise hydriertes) Pyrrolyl, Pyrazolyl, Imidazolyl, Triazolyl, Furyl, Thienyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Thiazolyl, Isothiazolyl, Oxadiazolyl, Thiadiazolyl, Pyridinyl, Pyrimidinyl, Triazinyl, Pyrazolylmethyl, Furylmethyl, Thienylmethyl, Oxazolylmethyl, Isoxazolylmethyl, Thiazolylmethyl, Pyridinylmethyl, Pyrimidinylmethyl, Pyrazolylmethoxy, Furylmethoxy oder Pyridylmethoxy steht,

R⁶ für Wasserstoff, Fluor oder Chlor steht,

R⁷ für Wasserstoff, Hydroxy, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, Acetyl, Propionyl, Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Propenyl, Butenyl, Propinyl oder Butinyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl oder Cyclohexylmethyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i- oder s-Butoxy, Propenyloxy oder Butenyloxy, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor,

Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, Difluormethyl oder Trifluormethoxy substituier-
tes Benzyl oder Benzylid steht, und

G für eine der nachstehenden Gruppierungen steht,



wobei

R^8 und R^9 gleich oder verschieden sind und einzeln für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl oder
zusammen für Ethan-1,2-diyl stehen, und

R^{10} für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl steht.

10 Die oben aufgeführten allgemeinen oder in Vorzugsbereichen angegebenen Restedefinitionen gelten sowohl
für die Endprodukte der Formel (I) als auch entsprechend für die jeweils zu Herstellung benötigten Ausgangs-
stoffe bzw. Zwischenprodukte. Diese Restedefinitionen können untereinander, also auch zwischen den angege-
benen Bereichen bevorzugter Verbindungen, beliebig kombiniert werden.

15 Beispiele für die möglichen Kombinationen der oben definierten Gruppierungen A, Q, R, R^2 und Ar sind
nachstehend aufgeführt:

20

25

30

35

40

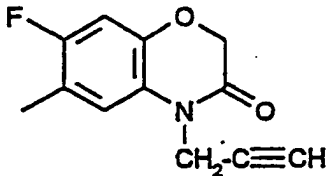
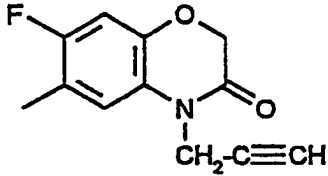
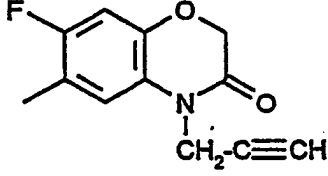
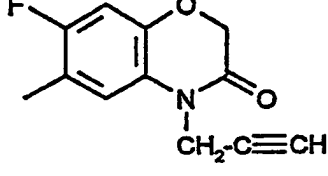
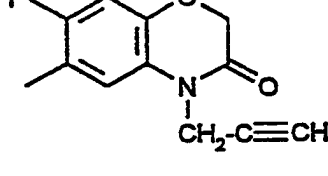
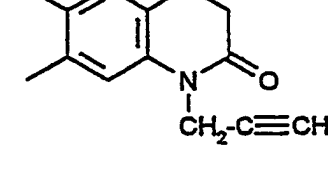

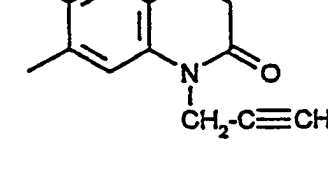
45


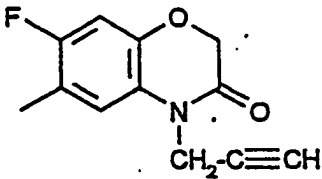

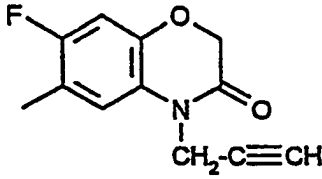
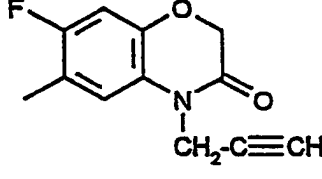
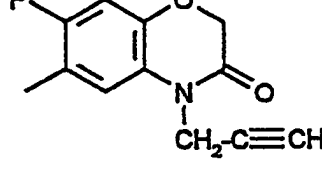
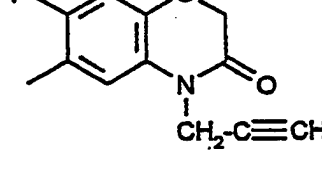
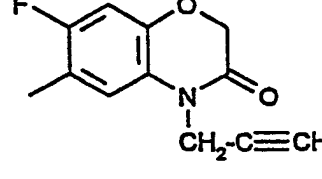
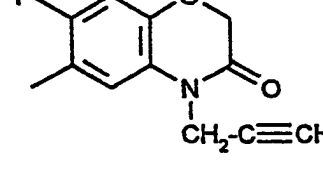
50

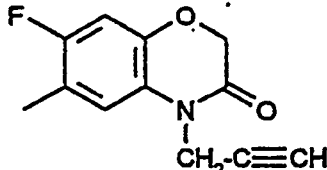
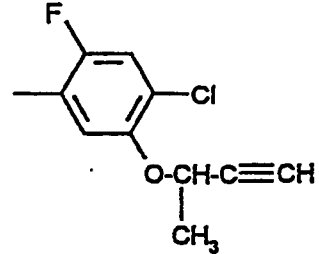
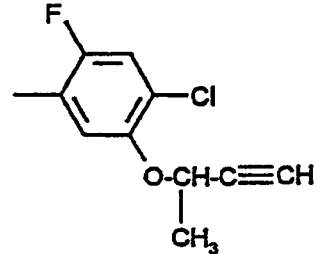
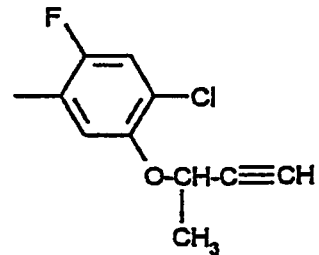
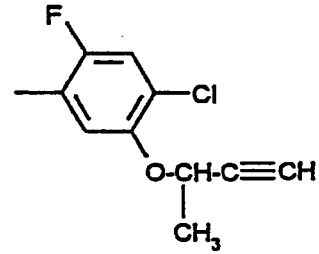
55

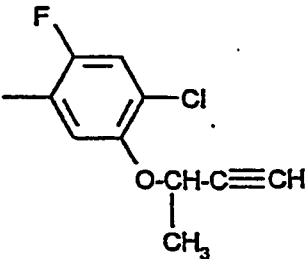
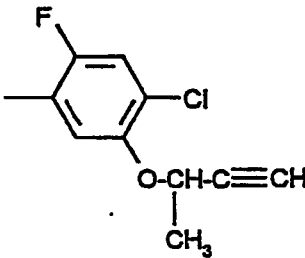

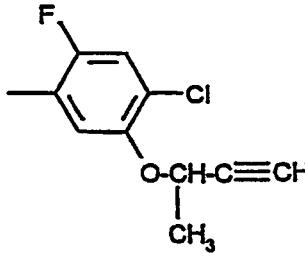

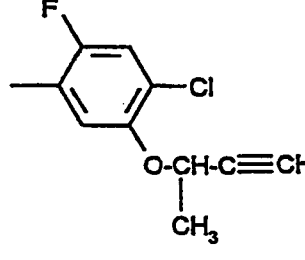

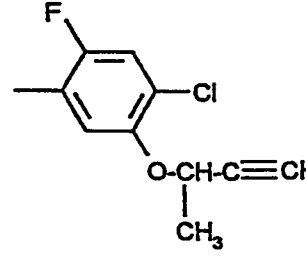
60

65

A	Q	R ¹	R ²		
S	O	C ₂ H ₅	CH ₃		5 10
S	O	CH ₃	CH ₂ F		15
S	O	C ₂ H ₅	CHF ₂		20 25
S	O	CH ₃	CF ₃		30
S	O	CHF ₂	C ₂ H ₅		35 40
S	O	CHF ₂	CH ₃		45
S	O		CHF ₂		50 55
					60
					65

	A	Q	R	R ²	Ar
5					
10	S	O		CH ₃	
15	S	O	CH ₃		
20					
25	S	O	n-C ₃ H ₇	CHF ₂	
30	S	O	n-C ₃ H ₇	C ₂ H ₅	
35					
40	S	O	n-C ₃ H ₇	CH ₃	
45	S	O	C ₂ H ₅	CH ₂ -C≡CH	
50					
55	S	O	C ₂ H ₅	CH ₂ -CH=CH ₂	
60					
65					

A	Q		R ²		
S	O	C ₂ H ₅	CH ₂ F		5
S	O	C ₂ H ₅	CH ₃		10
S	O	CH ₃	CH ₂ F		15
S	O	C ₂ H ₅	CHF ₂		20
S	O	CH ₃	CF ₃		25

A	Q	R	R ²	Ar
S	O	CHF ₂	C ₂ H ₅	
S	O	CHF ₂	CH ₃	
S	O		CHF ₂	
S	O		CH ₃	
S	O	CH ₃		

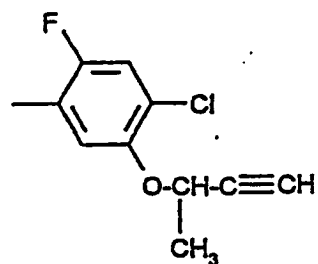
A

Q

R²

S

O

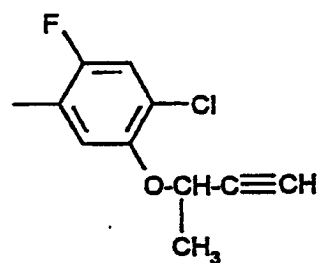
n-C₃H₇CHF₂

5

10

S

O

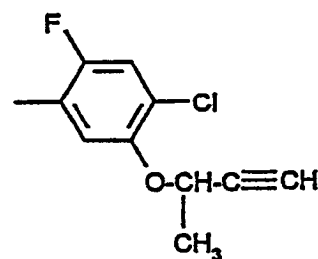
n-C₃H₇C₂H₅

15

20

S

O

n-C₃H₇CH₃

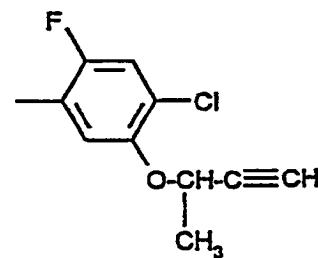
25

30

35

S

O

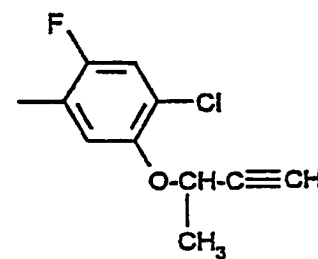
C₂H₅CH₂-C≡CH

40

45

S

O

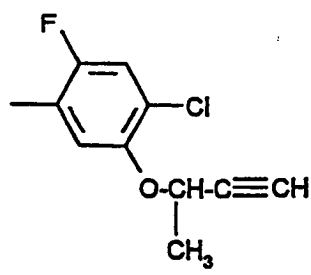
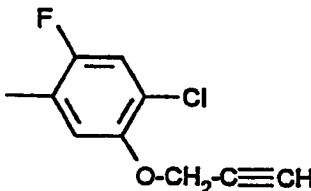
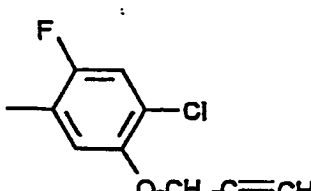
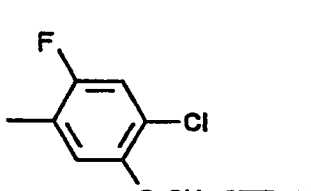
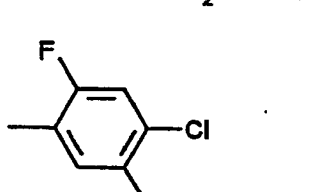
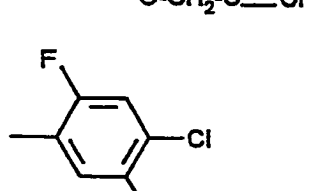
C₂H₅CH₂-CH=CH₂

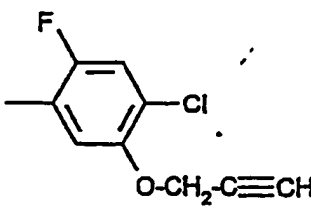
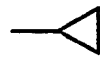
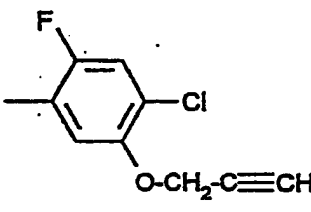
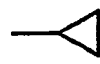
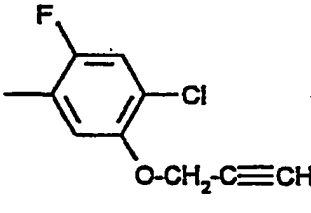
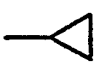
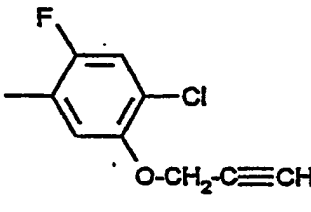
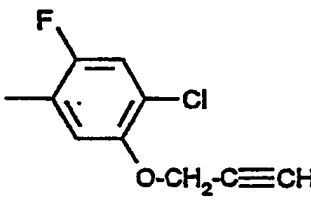
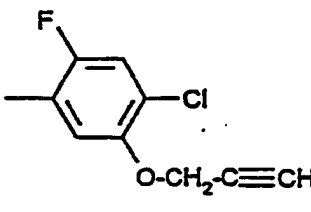
50

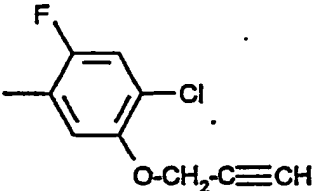
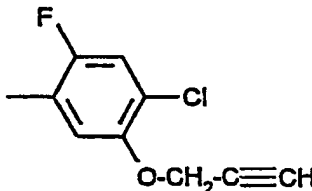
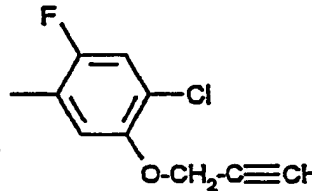
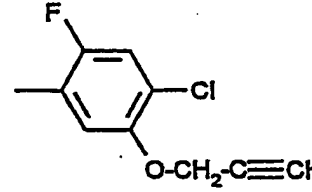
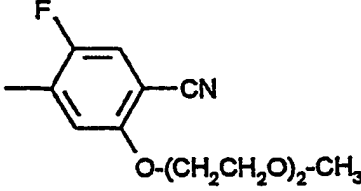
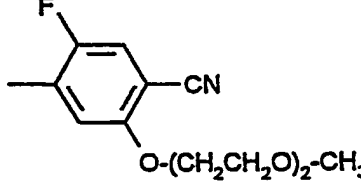
55

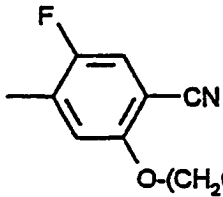
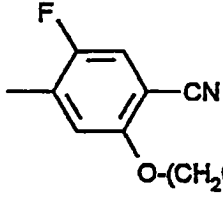
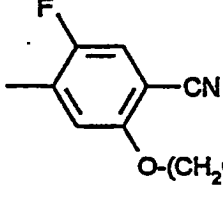
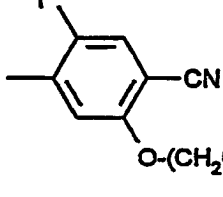
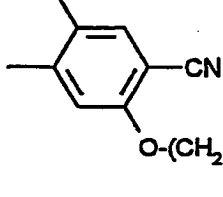
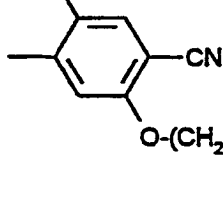
60

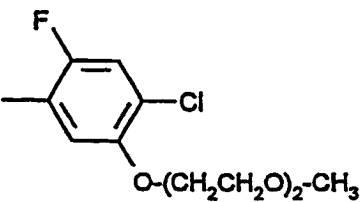
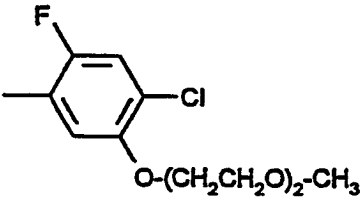
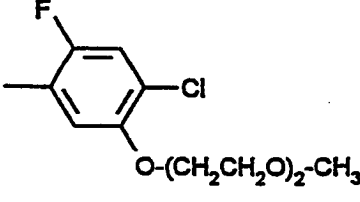
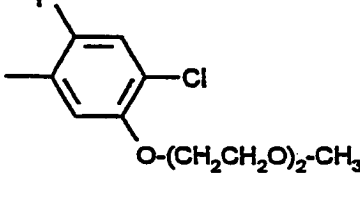
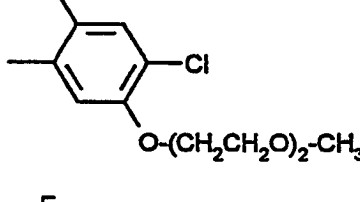
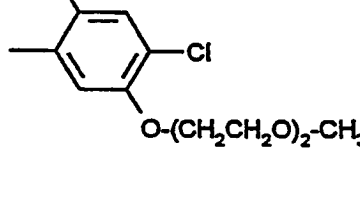
65

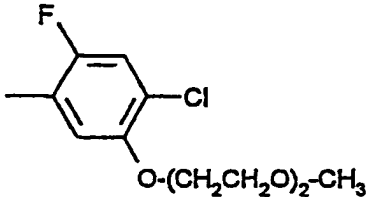
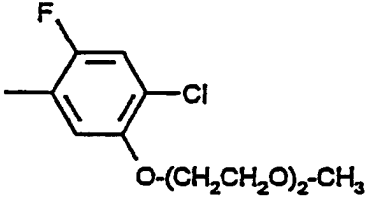
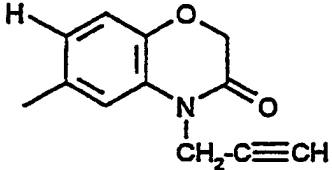
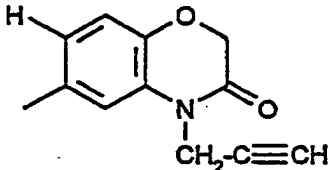
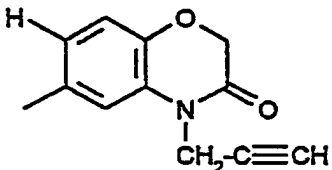
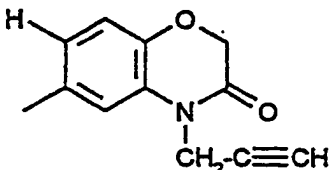
	A	Q	R	R ²	Ar
5					
10	S	O	C ₂ H ₅	CH ₂ F	
15					
20	S	O	C ₂ H ₅	CH ₃	
25					
30	S	O	CH ₃	CH ₂ F	
35					
40	S	O	C ₂ H ₅	CHF ₂	
45					
50	S	O	CH ₃	CF ₃	
55					
60	S	O	CHF ₂	C ₂ H ₅	
65					

A	Q		R ²		
S	O	CHF ₂	CH ₃		5 10
S	O		CHF ₂		15 20
S	O		CH ₃		25 30
S	O	CH ₃			35 40
S	O	n-C ₃ H ₇	CHF ₂		45 50
S	O	n-C ₃ H ₇	C ₂ H ₅		55 60 65

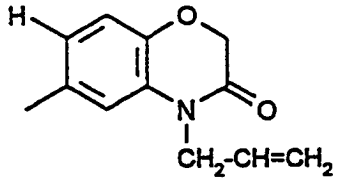
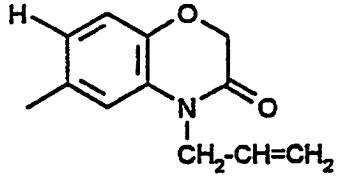
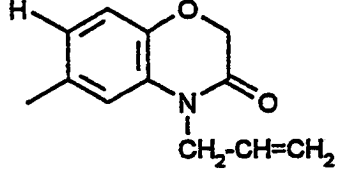
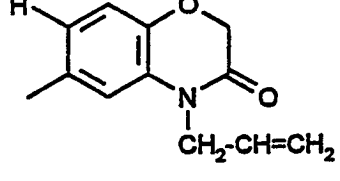
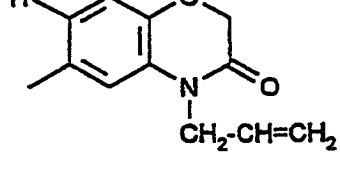
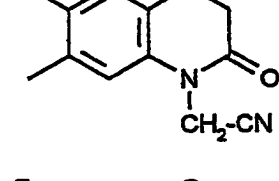
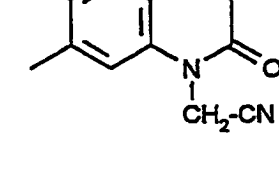
	A	Q	R	R ²	Ar
5					
10	S	O	n-C ₃ H ₇	CH ₃	
15	S	O	C ₂ H ₅	CH ₂ -C≡CH	
20					
25	S	O	C ₂ H ₅	CH ₂ -CH=CH ₂	
30					
35	S	O	C ₂ H ₅	CH ₂ F	
40	S	O	CH ₃	CH ₃	
45					
50	S	O	CH ₃	C ₂ H ₅	
55					
60					
65					

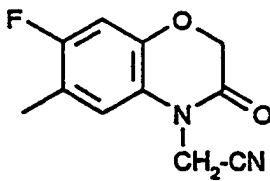
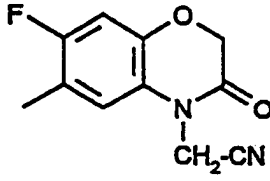
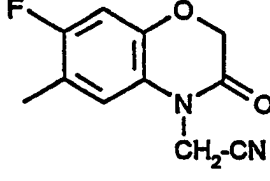
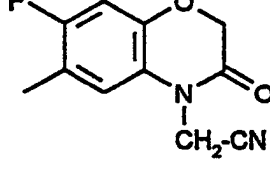
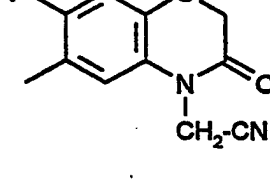
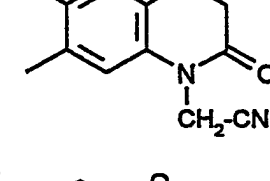
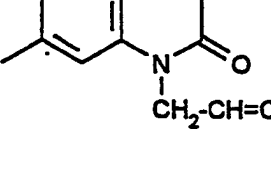
A	Q		R ²		
S	O	CH ₃	CH ₂ -CH=CH ₂		5 10
S	O	CH ₃	CH ₂ -C≡CH		15 20
S	O	CH ₃	CHF ₂		25 30
S	O	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅		35 40
S	O	CH ₃	CH ₂ F		45 50
S	O	CH ₃	CF ₃		55 60 65

	A	Q	R	R ²	Ar
5					
10	S	O	CH ₃	CH ₃	
15	S	O	CH ₃	C ₂ H ₅	
20					
25	S	O	CH ₃	CH ₂ -CH=CH ₂	
30					
35	S	O	CH ₃	CH ₂ -C≡CH	
40	S	O	CH ₃	CHF ₂	
45					
50	S	O	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
55					
60					
65					

A	Q		R ²		
S	O	CH ₃	CH ₂ F		5 10
S	O	CH ₃	CF ₃		15 20
S	O	CH ₃	CH ₃		25
S	O	CH ₃	C ₂ H ₅		30 35
S	O	CH ₃	CH ₂ -CH=CH ₂		40
S	O	CH ₃	CH ₂ -C≡CH		45 50
					55
					60
					65

	A	Q	R	R ²	Ar
5					
10	S	O	CH ₃	CHF ₂	
15	S	O	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
20	S	O	CH ₃	CH ₂ F	
25	S	O	CH ₃	CF ₃	
30	S	O	CH ₃	CH ₃	
35	S	O	CH ₃	CH ₃	
40	S	O	CH ₃	C ₂ H ₅	
45	S	O	CH ₃	CH ₂ -CH=CH ₂	
50	S	O	CH ₃	CH ₂ -CH=CH ₂	
55	S	O	CH ₃	CH ₂ -CH=CH ₂	
60					
65					

A	Q		R ²		
S	O	CH ₃	CH ₂ -C≡CH		5 10
S	O	CH ₃	CHF ₂		15
S	O	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅		20 25
S	O	CH ₃	CH ₂ F		30
S	O	CH ₃	CF ₃		35 40
S	O	CH ₃	CH ₃		45
S	O	CH ₃	C ₂ H ₅		50 55 60 65

	A	Q	R	R ²	Ar
5					
10	S	O	CH ₃	CH ₂ -CH=CH ₂	
15	S	O	CH ₃	CH ₂ -C≡CH	
20	S	O	CH ₃	CHF ₂	
25	S	O	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
30	S	O	CH ₃	CH ₂ F	
35	S	O	CH ₃	CF ₃	
40	S	O	CH ₃	CH ₃	
45					
50					
55					
60					
65					

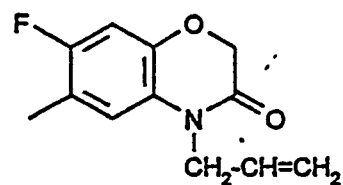
A

Q

R²

S

O

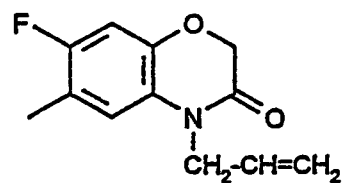
CH₃C₂H₅

5

10

S

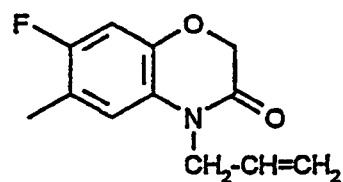
O

CH₃CH₂-CH=CH₂

15

S

O

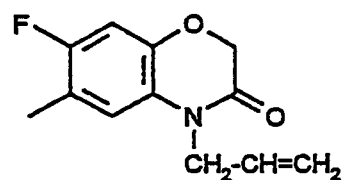
CH₃CH₂-C≡CH

20

25

S

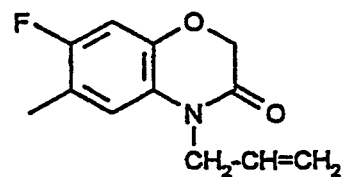
O

CH₃CHF₂

30

S

O

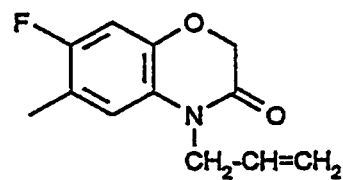
C₂H₅C₂H₅

35

40

S

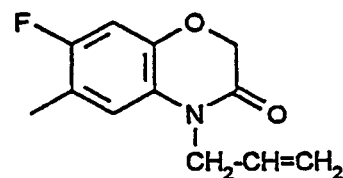
O

CH₃CH₂F

45

S

O

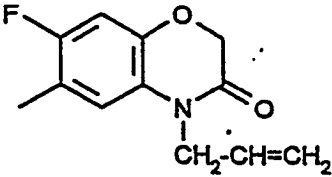
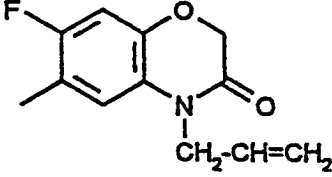
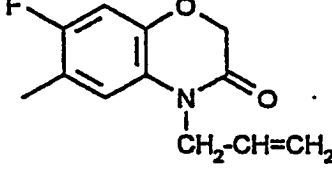
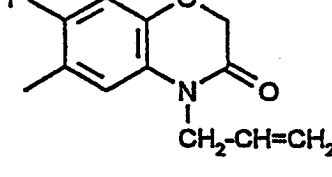
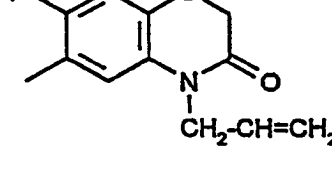
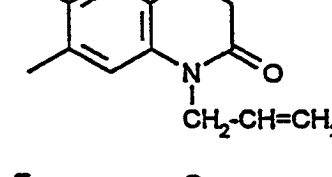

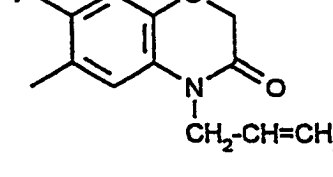
CH₃CF₃

50

55

60

65

	A	Q	R	R ²	Ar
5					
10	S	O	C ₂ H ₅	CH ₃	
15	S	O	CH ₃	CH ₂ F	
20	S	O	C ₂ H ₅	CHF ₂	
25	S	O	CH ₃	CF ₃	
30	S	O	CHF ₂	C ₂ H ₅	
35	S	O	CHF ₂	CH ₃	
40	S	O		CHF ₂	

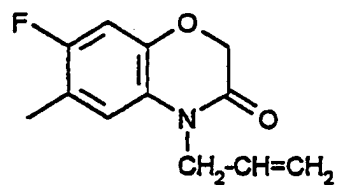
A

Q

R²

S

O

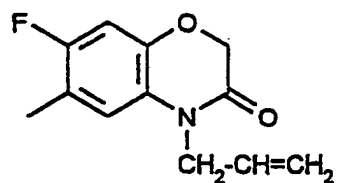
CH₃

5

10

S

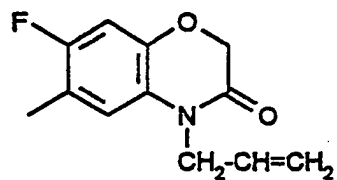
O

CH₃

15

S

O

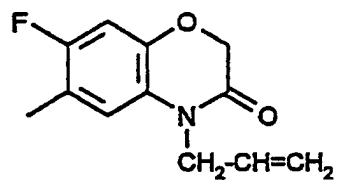
n-C₃H₇CHF₂

20

25

S

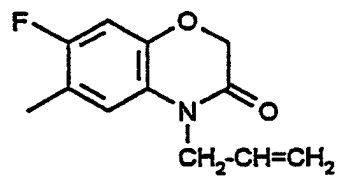
O

n-C₃H₇C₂H₅

30

S

O

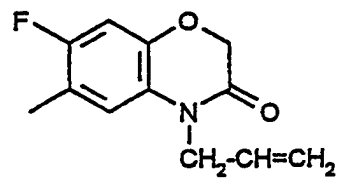
n-C₃H₇CH₃

35

40

S

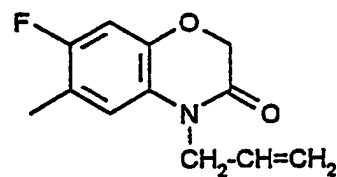
O

C₂H₅CH₂-C≡CH

45

S

O

C₂H₅CH₂-CH=CH₂

50

55

60

65

A

Q

R

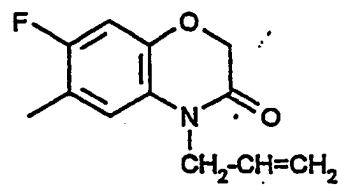
R²

Ar

5

S

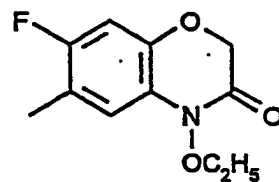
O

C₂H₅CH₂F

10

S

O

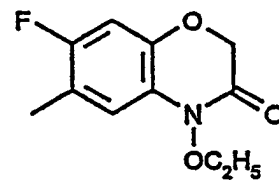
C₂H₅CH₃

15

20

S

O

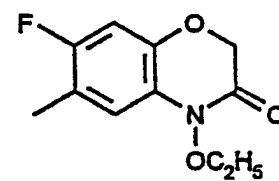
CH₃CH₂F

25

30

S

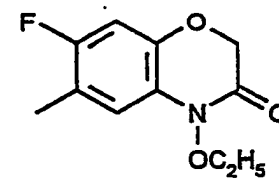
O

C₂H₅CHF₂

35

S

O

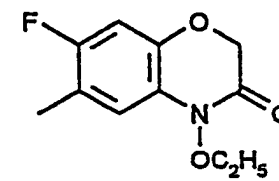
CH₃CF₃

40

45

S

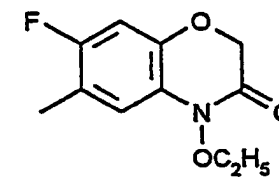
O

CHF₂C₂H₅

50

S


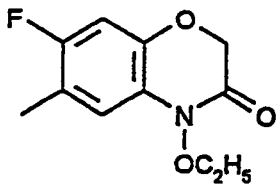

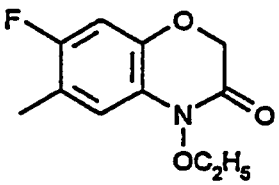
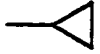
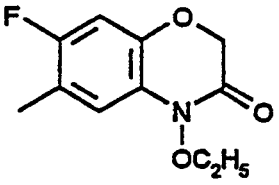
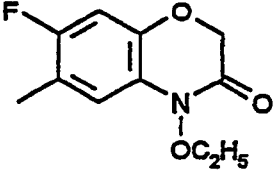
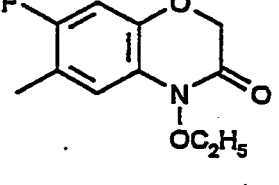
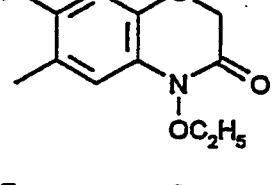
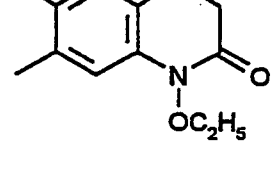
O

CHF₂CH₃

55

60

65

A	Q		R ²		
S	O		CHF ₂		5
S	O		CH ₃		10
S	O	CH ₃			15
S	O	n-C ₃ H ₇	CHF ₂		20
S	O	n-C ₃ H ₇	C ₂ H ₅		25
S	O	n-C ₃ H ₇	CH ₃		30
S	O	C ₂ H ₅	CH ₂ -C≡CH		35
					40
					45
					50
					55
					60
					65

A

Q

R

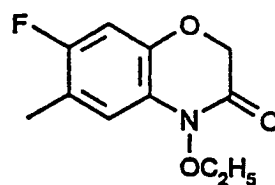
R²

Ar

5

S

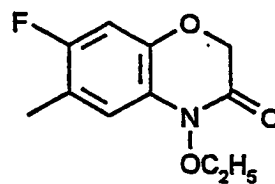
O

C₂H₅CH₂-CH=CH₂

10

S

O

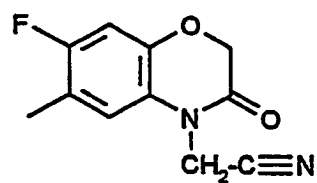
C₂H₅CH₂F

15

20

S

O

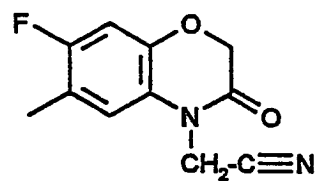
C₂H₅CH₃

25

30

S

O

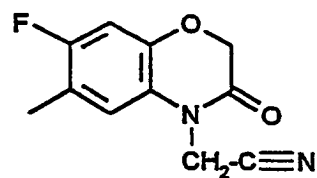
CH₃CH₂F

35

40

S

O

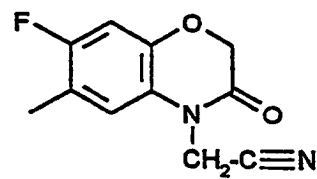
C₂H₅CHF₂

45

50

S

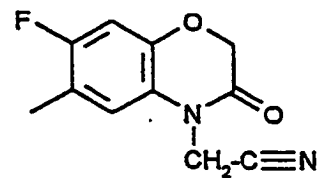
O

CH₃CF₃

55

S

O

CHF₂C₂H₅

60

65

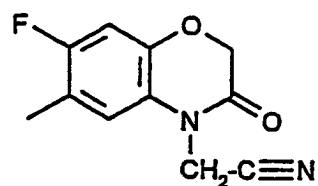
A

Q

R²

S

O

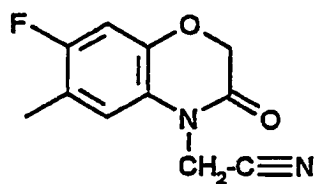
CHF₂CH₃

5

10

S

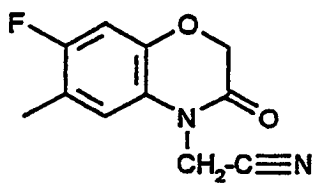
O

CHF₂

15

S

O

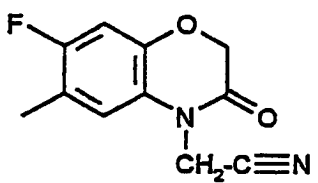
CH₃

20

25

S

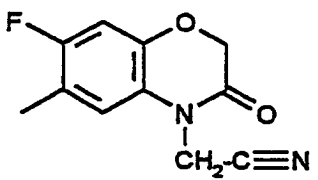
O

CH₃

30

S

O

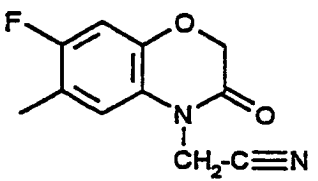
n-C₃H₇CHF₂

35

40

S

O

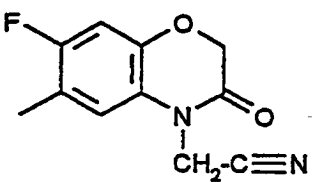
n-C₃H₇C₂H₅

45

50

S

O

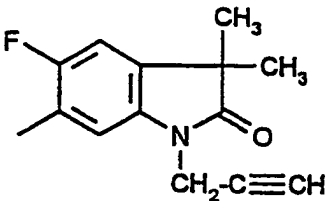
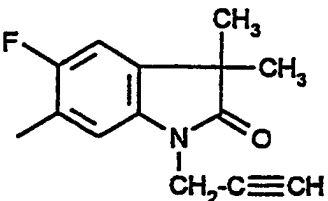
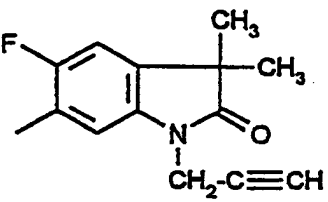

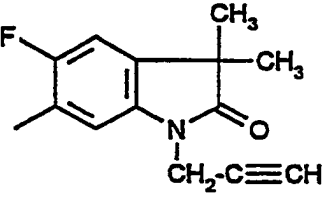

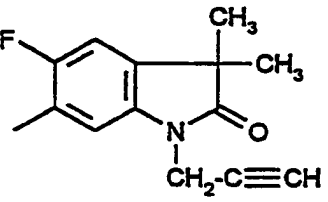

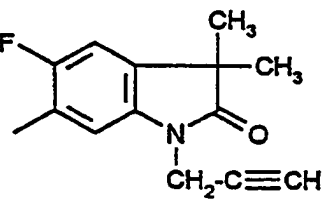
n-C₃H₇CH₃

55

60

65

A	Q	R	R ²	Ar
S	O	C ₂ H ₅	CH ₂ -C≡CH	
S	O	C ₂ H ₅	CH ₂ -CH=CH ₂	
S	O	C ₂ H ₅	CH ₂ F	
S	O	C ₂ H ₅	CH ₃	
S	O	CH ₃	CH ₂ F	
S	O	C ₂ H ₅	CHF ₂	

A	Q		R ²		
S	O	CH ₃	CF ₃		5 10
S	O	CHF ₂	C ₂ H ₅		15 20
S	O	CHF ₂	CH ₃		25 30
S	O		CHF ₂		35
S	O		CH ₃		40 45
S	O	CH ₃			50 55 60 65

A

Q

R

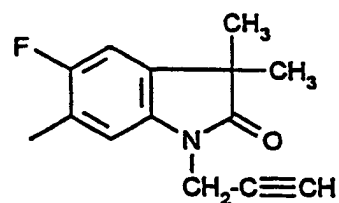
R²

Ar

5

S

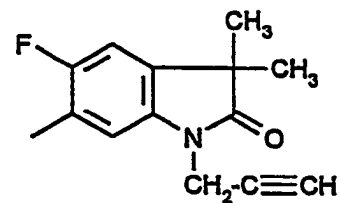
O

n-C₃H₇CHF₂

10

S

O

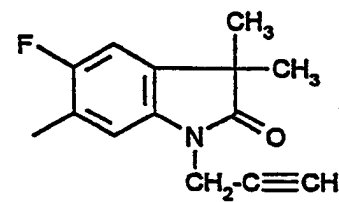
n-C₃H₇C₂H₅

15

20

S

O

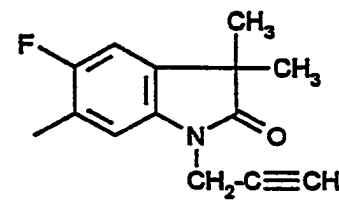
n-C₃H₇CH₃

25

30

S

O

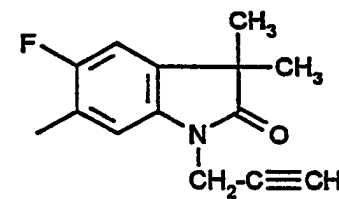
C₂H₅CH₂-C≡CH

35

40

S

O

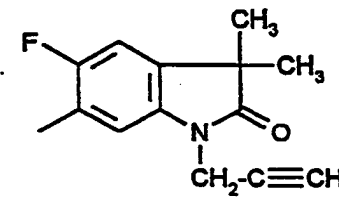
C₂H₅CH₂-C≡CH

45

50

S

O

C₂H₅CH₂F

55

60

65

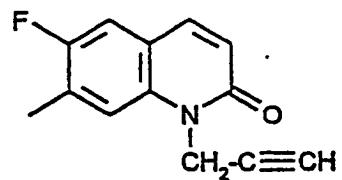
A

Q

R²

S

O

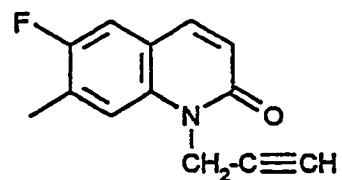
C₂H₅CH₃

5

10

S

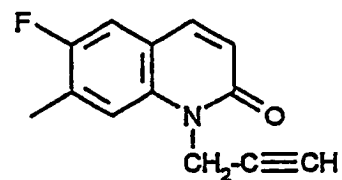
O

CH₃CH₂F

15

S

O

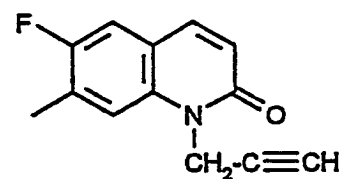
C₂H₅CHF₂

20

25

S

O

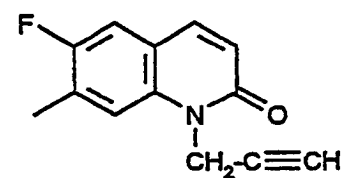
CH₃CF₃

30

35

S

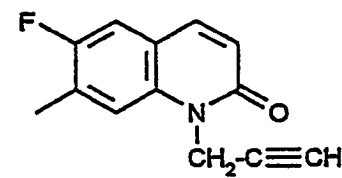
O

CHF₂C₂H₅

40

S

O

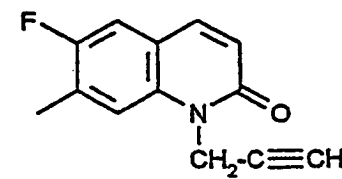
CHF₂CH₃

45

50

S


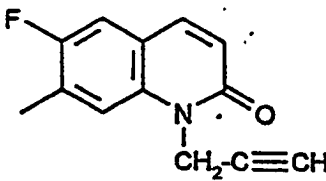

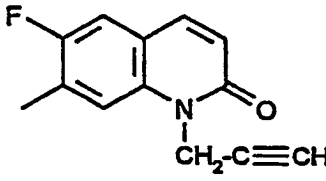
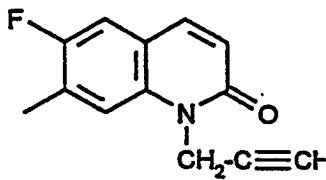
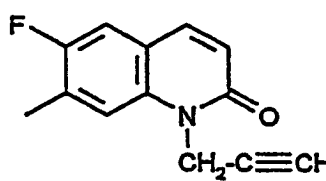
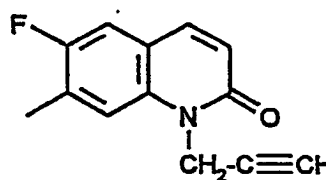
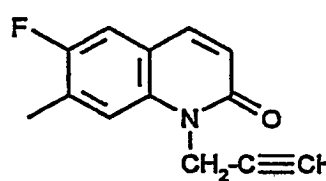
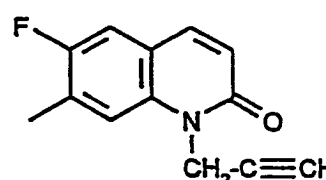



O

CHF₂

55

60

65

	A	Q	R	R ²	Ar
5					
	S	O		CH ₃	
10					
	S	O	CH ₃		
15					
	S	O	n-C ₃ H ₇	CHF ₂	
20					
	S	O	n-C ₃ H ₇	C ₂ H ₅	
25					
	S	O	n-C ₃ H ₇	CH ₃	
30					
	S	O	C ₂ H ₅	CH ₂ -C≡CH	
35					
	S	O	C ₂ H ₅	CH ₂ -C≡CH	
40					
	S	O	C ₂ H ₅	CH ₂ -C≡CH	
45					
	S	O	C ₂ H ₅	CH ₂ -C≡CH	
50					
	S	O	C ₂ H ₅	CH ₂ -C≡CH	
55					
	S	O	C ₂ H ₅	CH ₂ -C≡CH	
60					
	S	O	C ₂ H ₅	CH ₂ -C≡CH	
65					

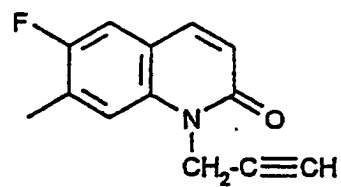
A

Q

R²

S

O

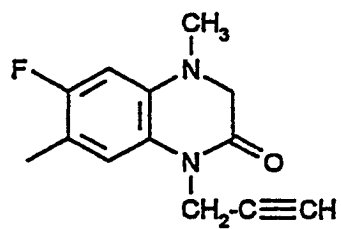
C₂H₅CH₂F

5

10

S

O

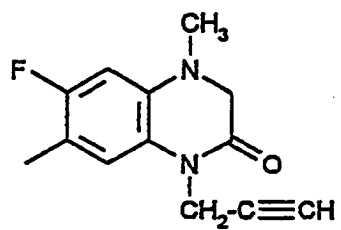
C₂H₅CH₃

15

20

S

O

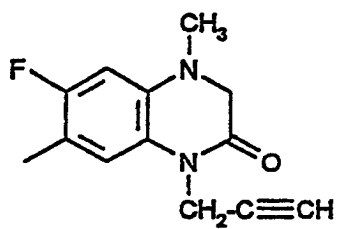
CH₃CH₂F

25

30

S

O

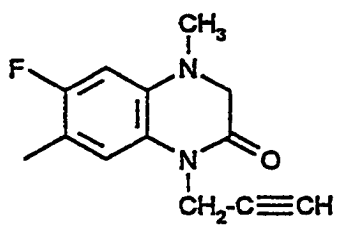
C₂H₅CHF₂

35

40

S

O

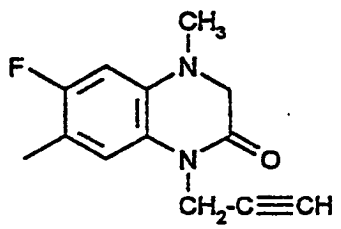
CH₃CF₃

45

50

S

O

CHF₂C₂H₅

55

60

65

A

Q

R

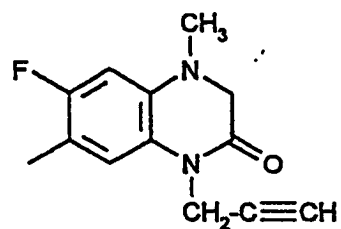
R²

Ar

5

S

O

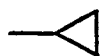
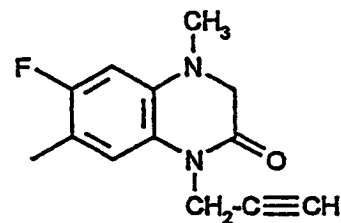
CHF₂CH₃

10

15

S

O

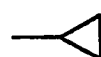
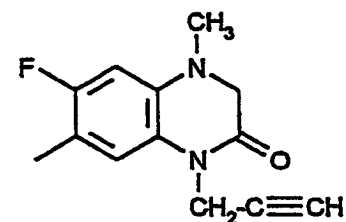
CHF₂

20

25

S

O

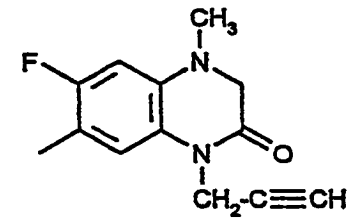
CH₃

35

40

S

O

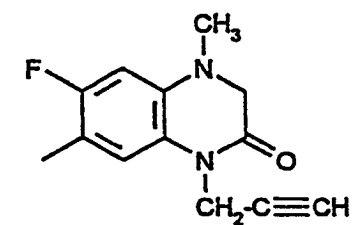
CH₃

45

50

S

O

n-C₃H₇CHF₂

55

60

65

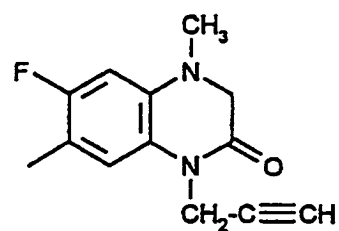
A

Q

R²

S

O

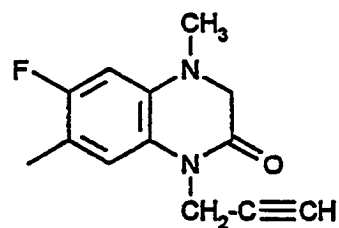
n-C₃H₇C₂H₅

5

10

S

O

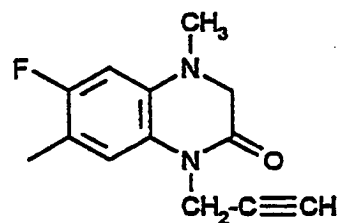
n-C₃H₇CH₃

15

20

S

O

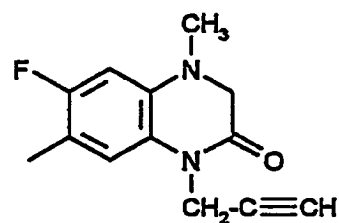
C₂H₅CH₂-C≡CH

25

30

S

O

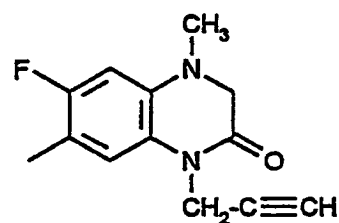
C₂H₅CH₂-CH=CH₂

35

40

S

O

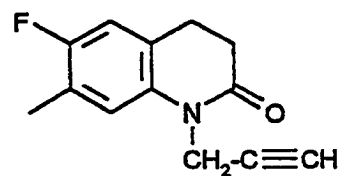
C₂H₅CH₂F

45

50

S

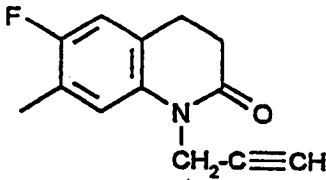
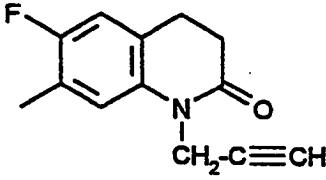
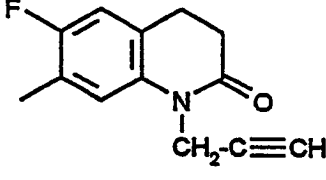
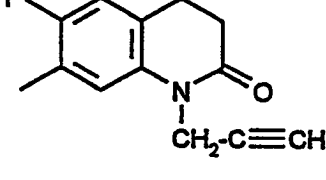
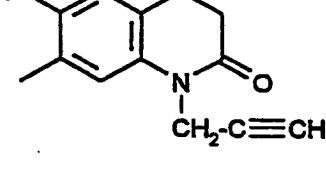

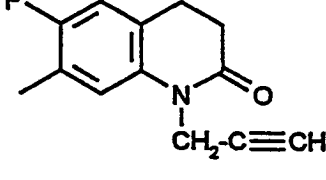

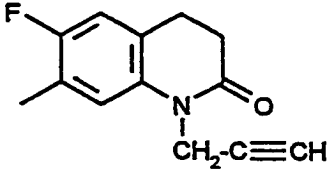
O

C₂H₅CH₃

55

60

65

	A	Q	R	R ²	Ar
5					
10	S	O	CH ₃	CH ₂ F	
15	S	O	C ₂ H ₅	CHF ₂	
20	S	O	CH ₃	CF ₃	
25	S	O	CHF ₂	C ₂ H ₅	
30	S	O	CHF ₂	CH ₃	
35	S	O		CHF ₂	
40	S	O		CH ₃	

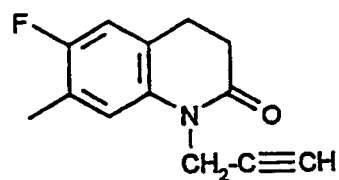
A

Q

R²

S

O

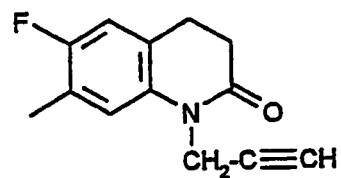
CH₃

5

10

S

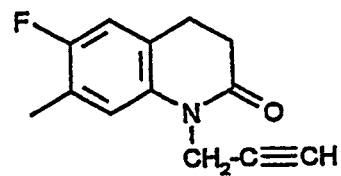
O

n-C₃H₇CHF₂

15

S

O

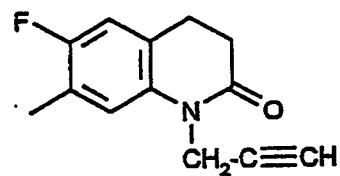
n-C₃H₇C₂H₅

20

25

S

O

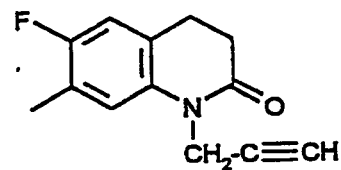
n-C₃H₇CH₃

30

35

S

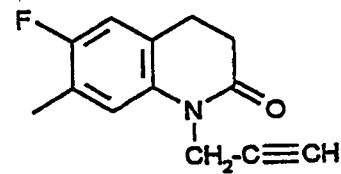
O

C₂H₅CH₂-C≡CH

40

S

O

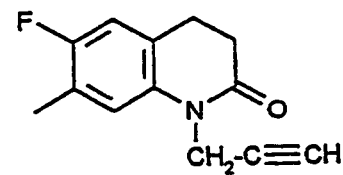
C₂H₅CH₂-C≡CH

45

50

S

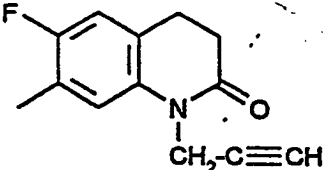
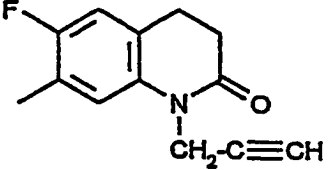
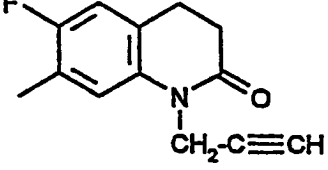
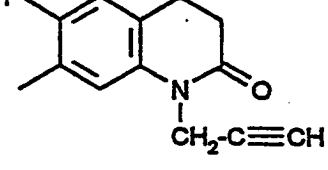
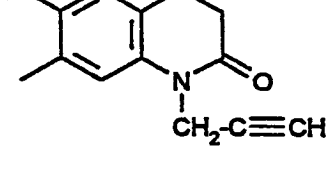
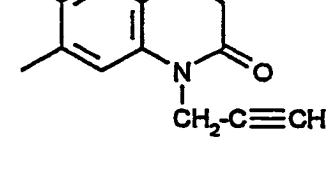
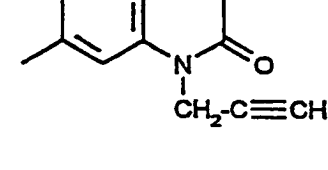
O

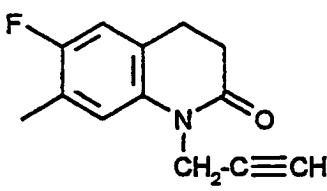
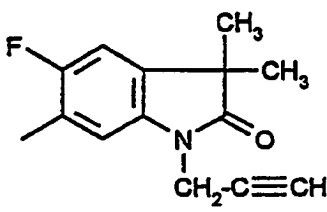
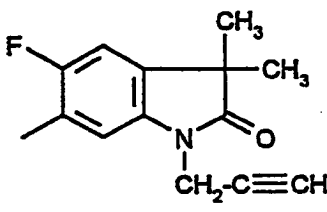
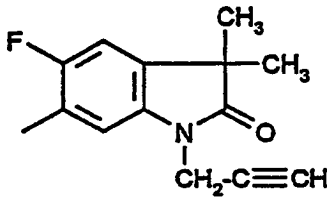
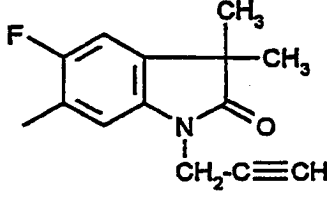
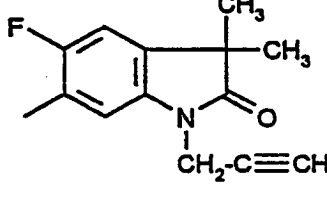
C₂H₅CH₂F

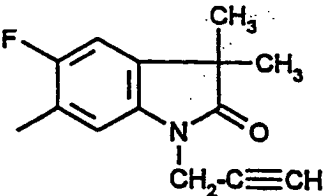
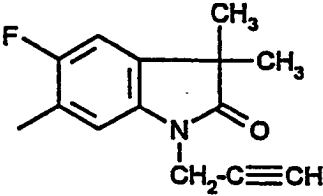
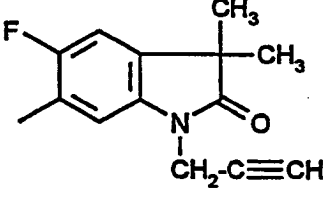
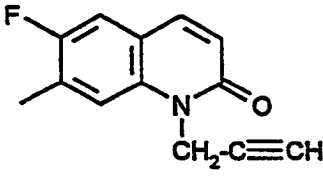
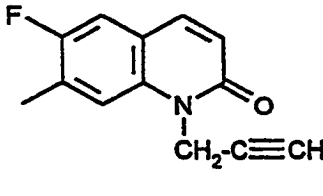
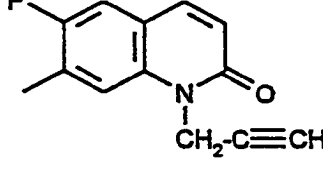
55

60

65

	A	Q	R	R ²	Ar
5					
10	S	O	CH ₃	CH ₃	
15	S	O	CH ₃	C ₂ H ₅	
20					
25	S	O	CH ₃	CH ₂ -CH=CH ₂	
30	S	O	CH ₃	CH ₂ -C≡CH	
35					
40	S	O	CH ₃	CHF ₂	
45	S	O	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
50					
55	S	O	CH ₃	CH ₂ F	

A	Q		R ²		
S	O	CH ₃	CF ₃		5 10
S	O	CH ₃	CH ₃		15 20
S	O	CH ₃	C ₂ H ₅		25 30
S	O	CH ₃	CH ₂ -CH=CH ₂		35 40
S	O	CH ₃	CH ₂ -C≡CH		45 50
S	O	CH ₃	CHF ₂		55 60 65

	A	Q	R	R ²	Ar
5					
10	S	O	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
15	S	O	CH ₃	CH ₂ F	
20					
25	S	O	CH ₃	CF ₃	
30					
35	S	O	CH ₃	CH ₃	
40					
45	S	O	CH ₃	C ₂ H ₅	
50					
55	S	O	CH ₃	CH ₂ -CH=CH ₂	
60					
65					

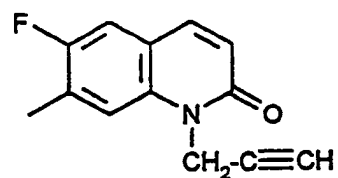
A

Q

R²

S

O

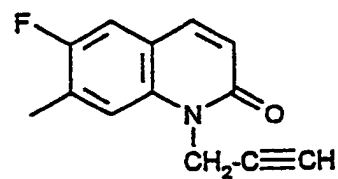
CH₃CH₂-C≡CH

5

10

S

O

CH₃CHF₂

15

S

O

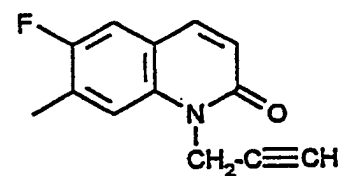
C₂H₅C₂H₅

20

25

S

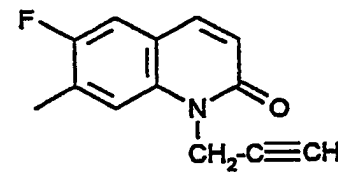
O

CH₃CH₂F

30

S

O

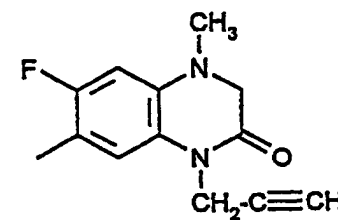
CH₃CF₃

35

40

S

O

CH₃CH₃

45

50

55

60

65

5

A

O

R

R²

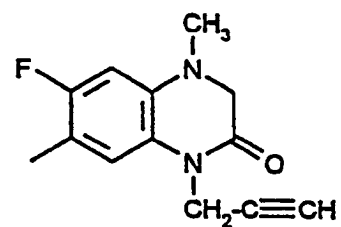
Ar

S

O

CH₃C₂H₅

10



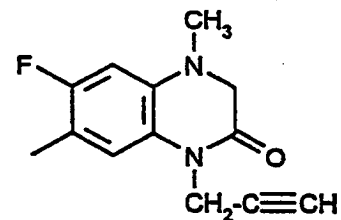
15

S

O

CH₃CH₂-CH=CH₂

20



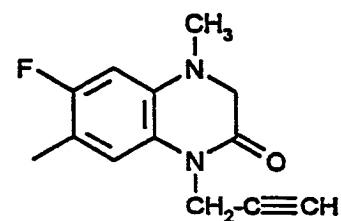
25

S

O

CH₃CH₂-C≡CH

30



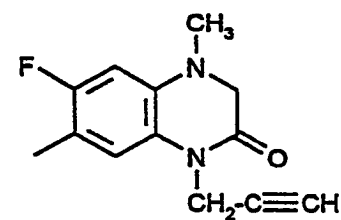
35

S

O

CH₃CHF₂

40



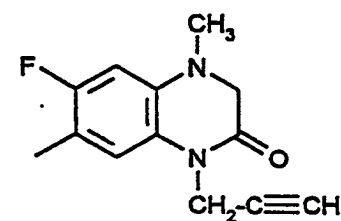
45

S

O

C₂H₅C₂H₅

50



55

60

65

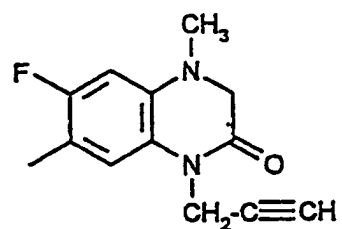
A

Q

R²

S

O

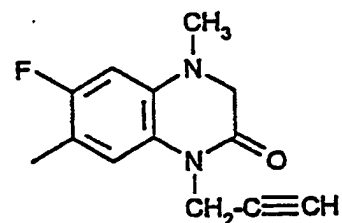
CH₃CH₂F

5

10

S

O

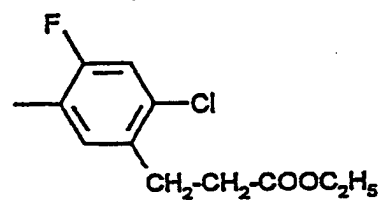
CH₃CF₃

15

20

S

O

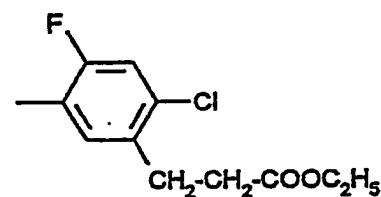
CH₃CH₃

25

30

S

O

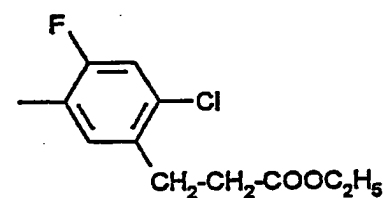
CH₃C₂H₅

35

40

S

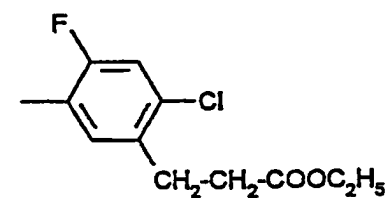
O

CH₃CH₂-CH=CH₂

45

S

O

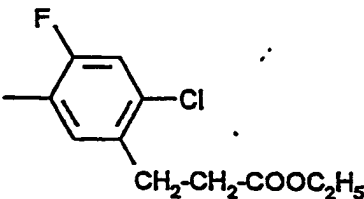
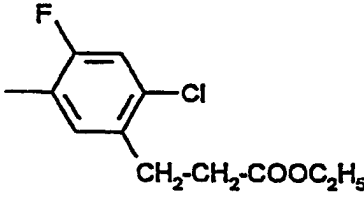
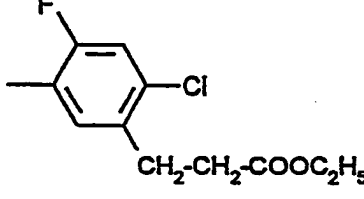
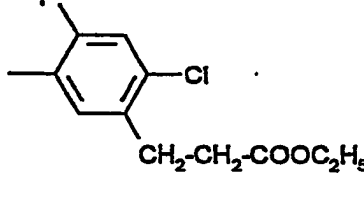
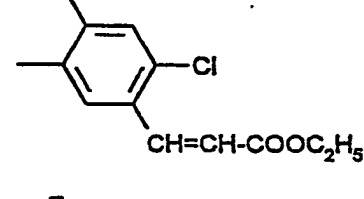
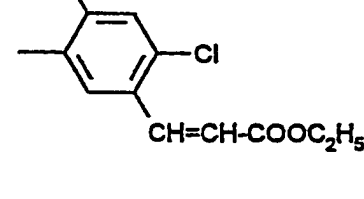
CH₃CH₂-C≡CH

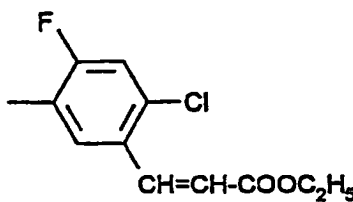
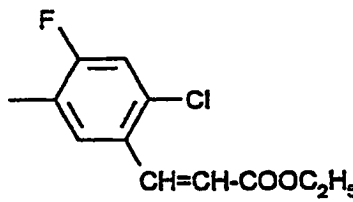
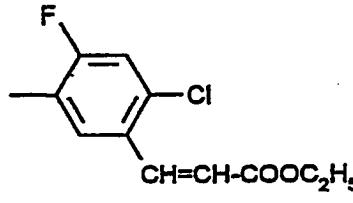
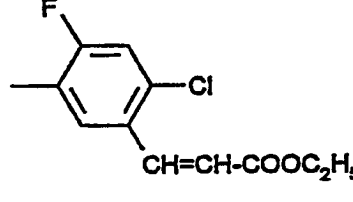
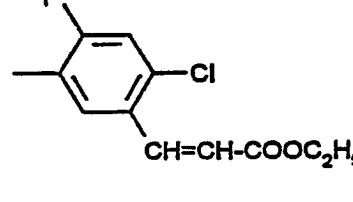
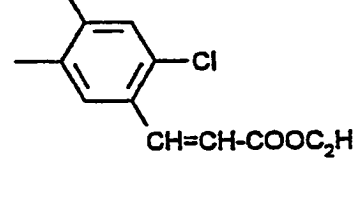
50

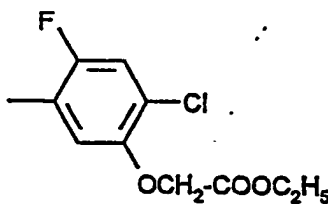
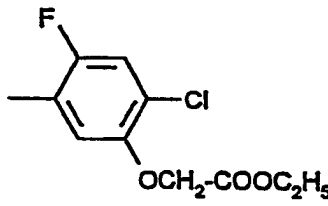
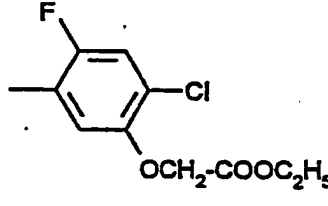
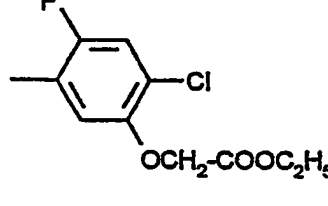
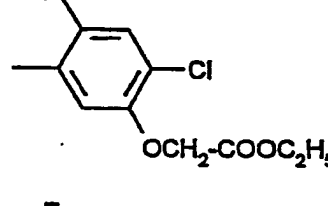
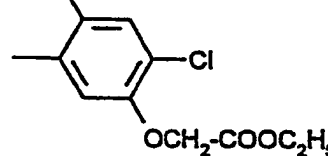
55

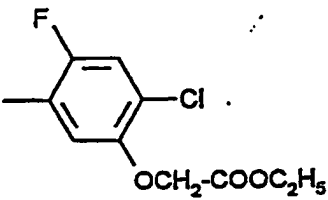
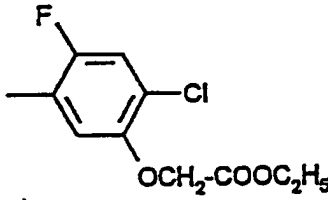
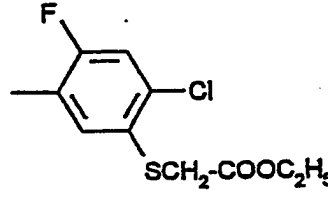
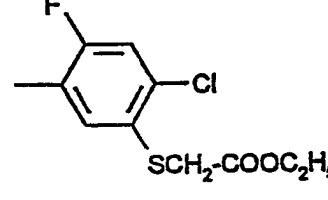
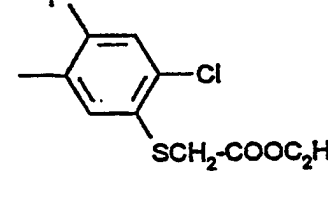
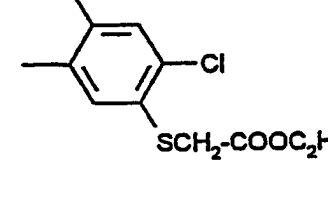
60

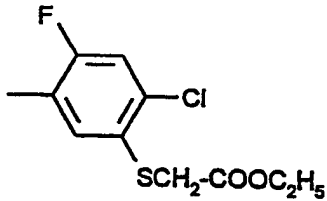
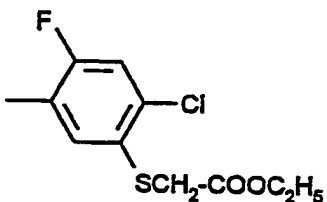
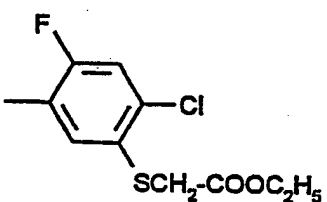
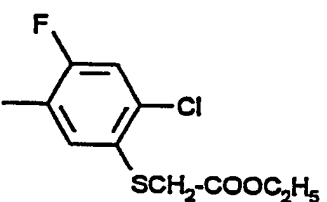
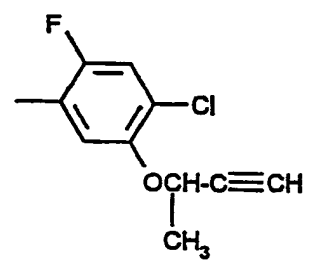
65

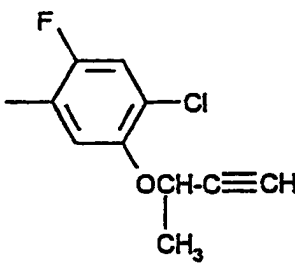
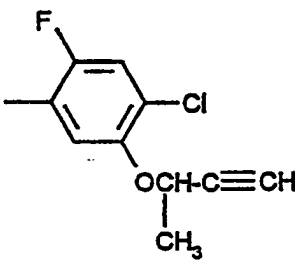
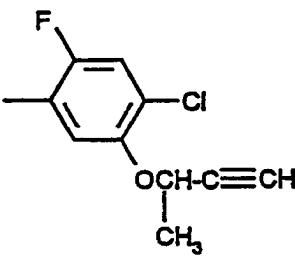
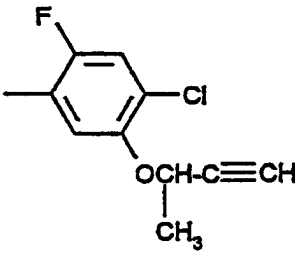
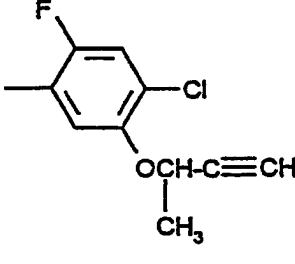
	A	Q	R	R ²	Ar
5					
10	S	O	CH ₃	CHF ₂	
15	S	O	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
20					
25	S	O	CH ₃	CH ₂ F	
30					
35	S	O	CH ₃	CF ₃	
40					
45	S	O	CH ₃	CH ₃	
50	S	O	CH ₃	C ₂ H ₅	
55					
60					
65					

A	Q		R ²		
S	O	CH ₃	CH ₂ -CH=CH ₂		5 10
S	O	CH ₃	CH ₂ -C≡CH		15 20
S	O	CH ₃	CHF ₂		25 30
S	O	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅		35 40
S	O	CH ₃	CH ₂ F		45 50
S	O	CH ₃	CF ₃		55 60 65

A	Q	R	R ²	Ar	
5					
10	S	O	CH ₃	CH ₃	
15	S	O	CH ₃	C ₂ H ₅	
20	S	O	CH ₃	CH ₂ -CH=CH ₂	
25	S	O	CH ₃	CH ₂ -C≡CH	
30	S	O	CH ₃	CHF ₂	
35	S	O	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
40					
45					
50					
55					
60					
65					

A	Q		R ²		
S	O	CH ₃	CH ₂ F		5 10
S	O	CH ₃	CF ₃		15 20
S	O	CH ₃	CH ₃		25 30
S	O	CH ₃	C ₂ H ₅		35 40
S	O	CH ₃	CH ₂ -CH=CH ₂		45 50
S	O	CH ₃	CH ₂ -C≡CH		55 60 65

	A	C	R	R ²	Ar
5					
10	S	O	CH ₃	CHF ₂	
15	S	O	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
20					
25	S	O	CH ₃	CH ₂ F	
30					
35	S	O	CH ₃	CF ₃	
40	S	O	CH ₃	CH ₃	
45					
50					
55					
60					
65					

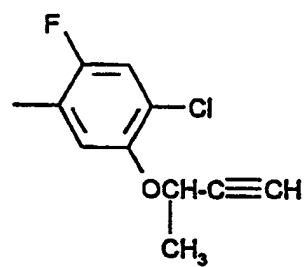
A	Q		R ²		
S	O	CH ₃	C ₂ H ₅		5 10 15
S	O	CH ₃	CH ₂ -CH=CH ₂		20 25
S	O	CH ₃	CH ₂ -C≡CH		30 35
S	O	CH ₃	CHF ₂		40 45
S	O	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅		50 55 60 65

A	Q	R	R ²	Ar
---	---	---	----------------	----

5

S

O

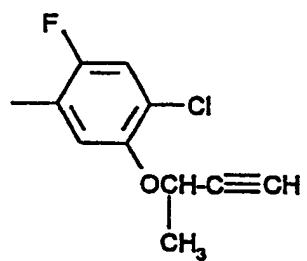
CH₃CH₂F

10

15

S

O

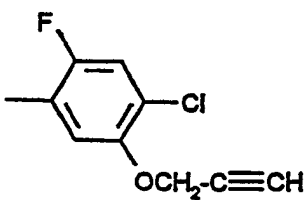
CH₃CF₃

20

25

S

O

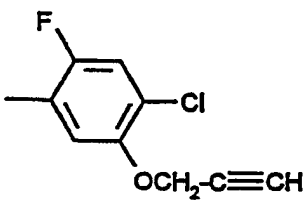
CH₃CH₃

35

40

S

O

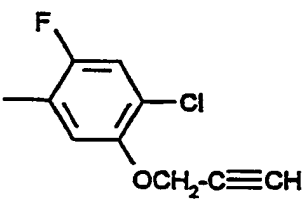
CH₃C₂H₅

45

50

S

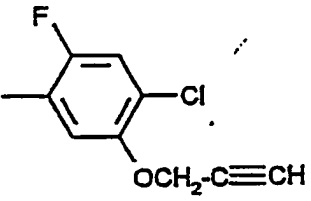
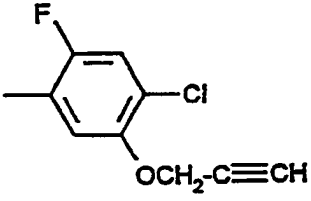
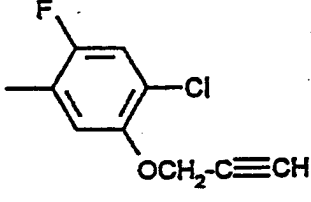
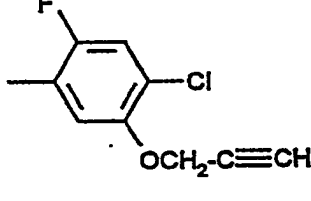
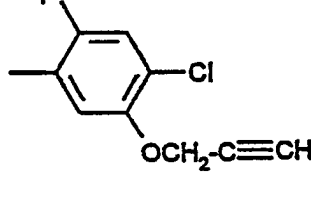
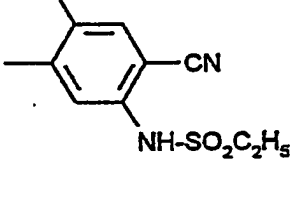
O

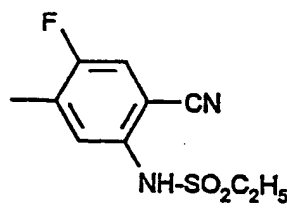
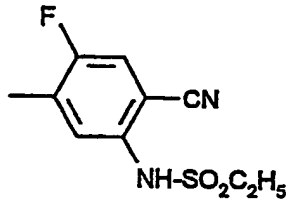
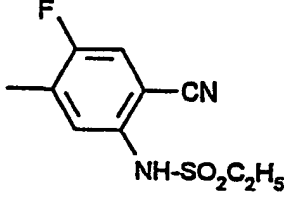
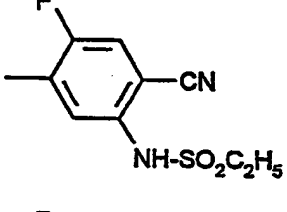
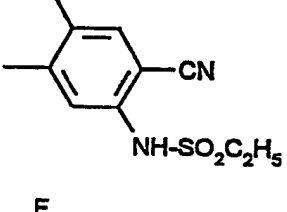
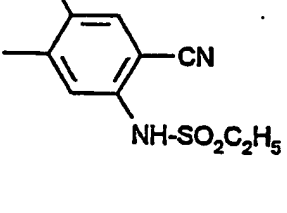
CH₃CH₂-CH=CH₂

55

60

65

A	Q		R ²		
S	O	CH ₃	CH ₂ -C≡CH		5 10
S	O	CH ₃	CHF ₂		15 20
S	O	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅		25 30
S	O	CH ₃	CH ₂ F		35 40
S	O	CH ₃	CF ₃		45 50
S	O	CH ₃	CH ₃		55 60 65

	A	Q	R	R ²	Ar
5					
10	S	O	CH ₃	C ₂ H ₅	
15	S	O	CH ₃	CH ₂ -CH=CH ₂	
20					
25	S	O	CH ₃	CH ₂ -C≡CH	
30					
35	S	O	CH ₃	CHF ₂	
40	S	O	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
45					
50	S	O	CH ₃	CH ₂ F	
55					
60					
65					

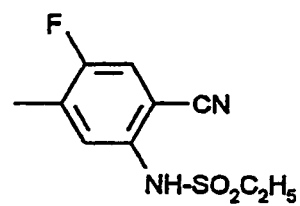
A

Q

R²

S

O

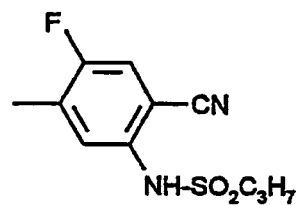
CH₃CF₃

5

10

S

O

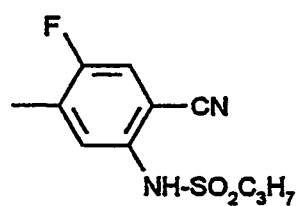
CH₃CH₃

15

20

S

O

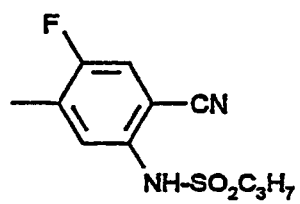
CH₃C₂H₅

25

30

S

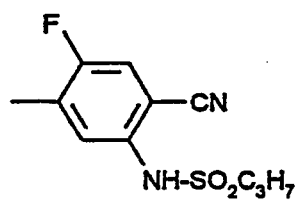
O

CH₃CH₂-CH=CH₂

35

S

O

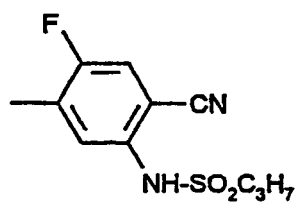
CH₃CH₂-C≡CH

40

45

S

O

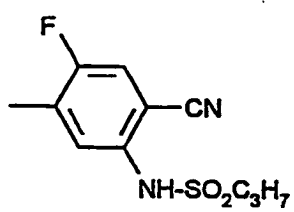
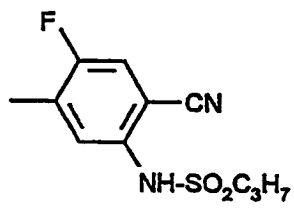
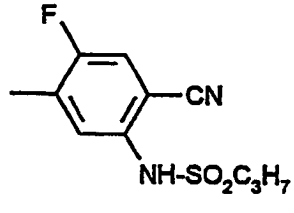
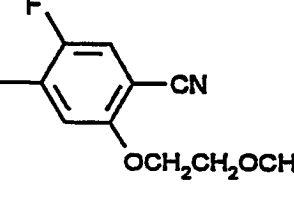
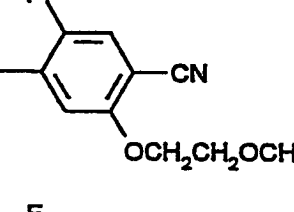
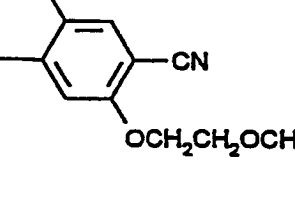
CH₃CHF₂

50

55

60

65

	A	Q	R	R ²	Ar
5					
10	S	O	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
15	S	O	CH ₃	CH ₂ F	
20					
25	S	O	CH ₃	CF ₃	
30					
35	S	O	C ₂ H ₅	CH ₃	
40					
45	S	O	CH ₃	CH ₂ F	
50					
55	S	O	C ₂ H ₅	CHF ₂	
60					
65					

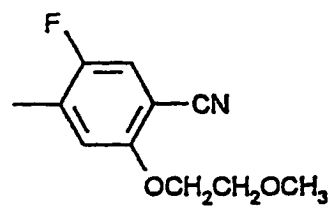
A

Q

R²

S

O

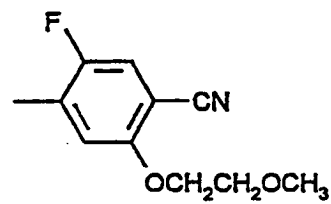
CH₃CF₃

5

10

S

O

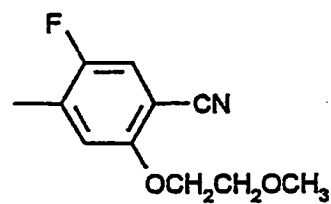
CHF₂C₂H₅

15

20

S

O

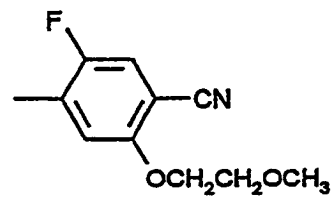
CHF₂CH₃

25

30

S

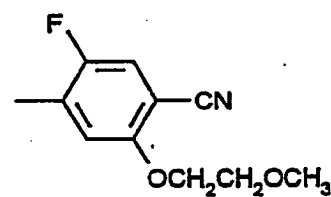
O

CHF₂

35

S

O

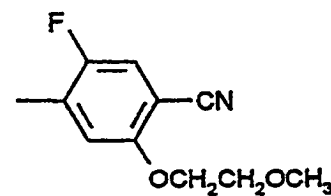
CH₃

40

45

S

O

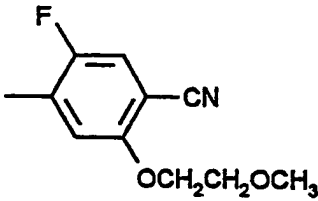
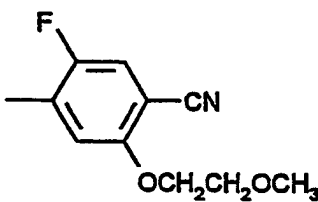
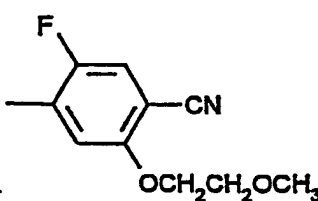
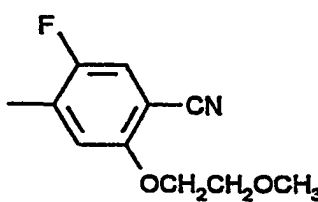
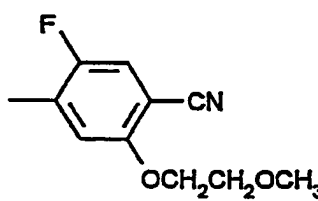
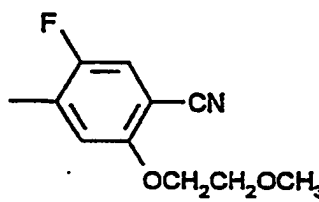
CH₃

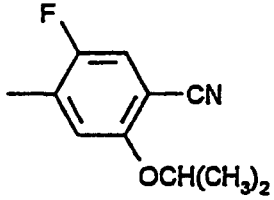
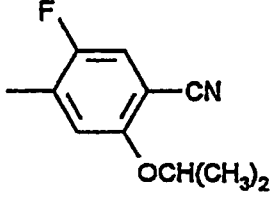
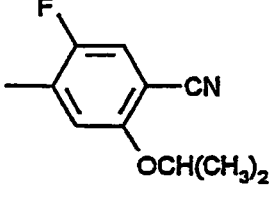
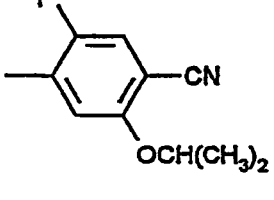
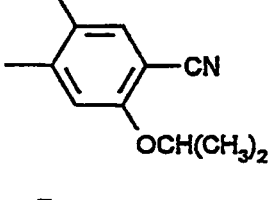
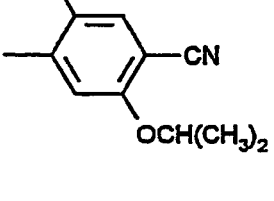
50


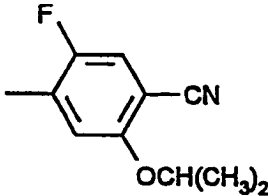

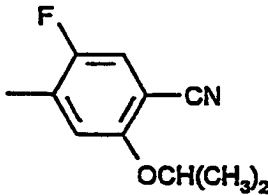

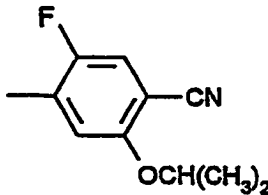
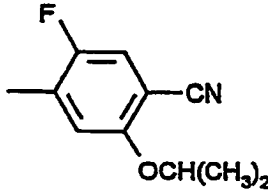
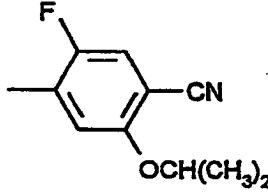
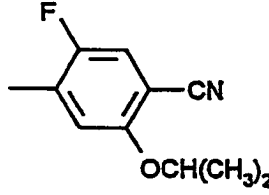
55

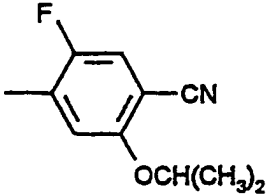
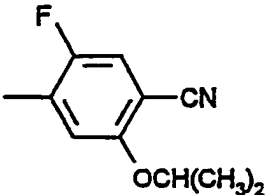
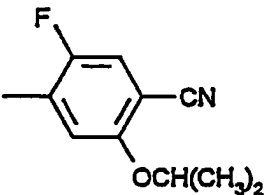
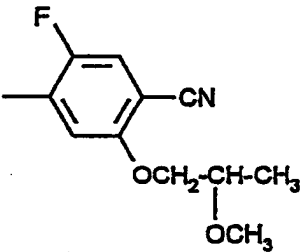
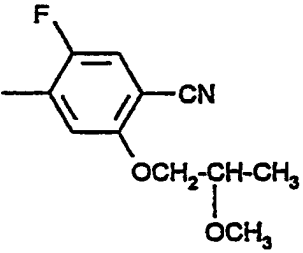
60

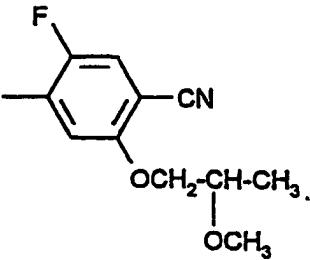
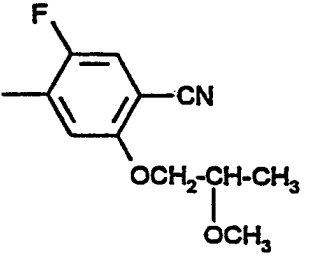
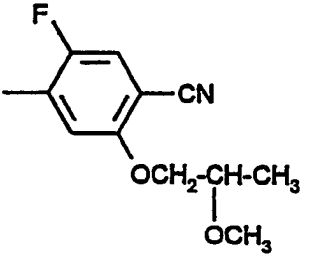
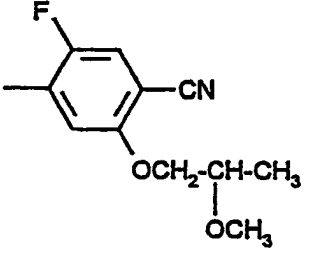
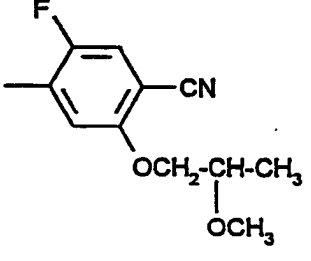
65

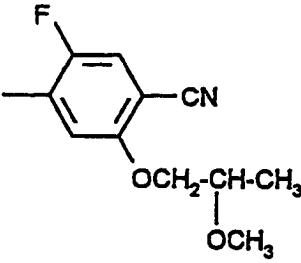
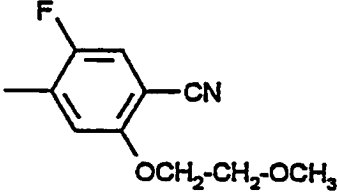
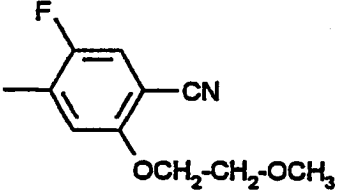
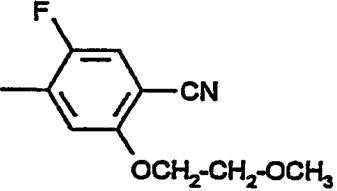
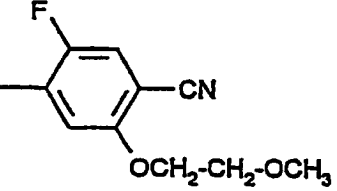
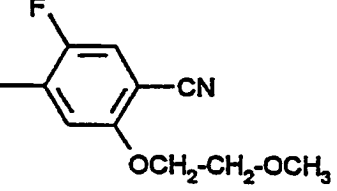
A	Q	R	R ²	Ar
5				
S	O	n-C ₃ H ₇	CHF ₂	
10				
S	O	n-C ₃ H ₇	C ₂ H ₅	
15				
S	O	n-C ₃ H ₇	CH ₃	
20				
S	O	C ₂ H ₅	CH ₂ -C≡CH	
25				
S	O	C ₂ H ₅	CH ₂ -C≡CH	
30				
S	O	C ₂ H ₅	CH ₂ F	
35				
40				
45				
50				
55				
60				
65				

A	Q		R ²		
S	O	C ₂ H ₅	CH ₃		5 10
S	O	CH ₃	CH ₂ F		15 20
S	O	C ₂ H ₅	CHF ₂		25 30
S	O	CH ₃	CF ₃		35 40
S	O	CHF ₂	C ₂ H ₅		45 50
S	O	CHF ₂	CH ₃		55 60 65

	A	Q	R	R ²	Ar
5					
10	S	O		CHF ₂	
15	S	O		CH ₃	
20					
25	S	O	CH ₃		
30					
35	S	O	n-C ₃ H ₇	CHF ₂	
40	S	O	n-C ₃ H ₇	C ₂ H ₅	
45					
50	S	O	n-C ₃ H ₇	CH ₃	
55					
60					
65					

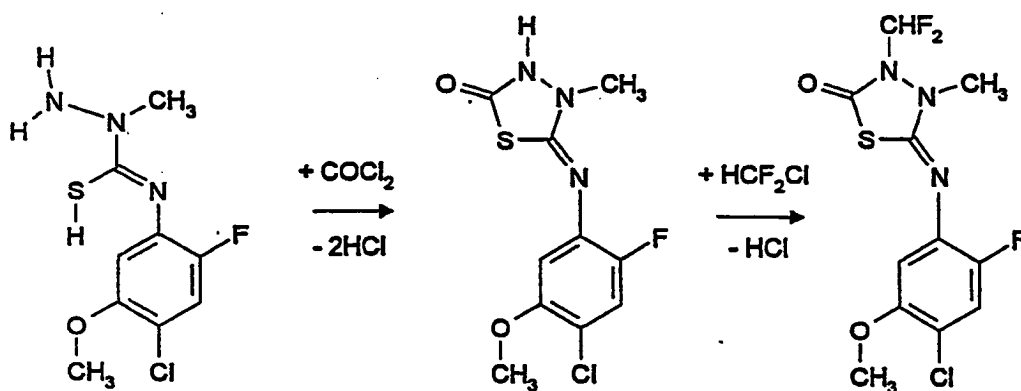
A	Q		R ²		
S	O	C ₂ H ₅	CH ₂ -C≡CH		5 10
S	O	C ₂ H ₅	CH ₂ -C≡CH		15 20
S	O	C ₂ H ₅	CH ₂ F		25 30
S	O	CH ₃	CH ₃		35 40
S	O	CH ₃	C ₂ H ₅		45 50 55 60 65

A	Q	R	R ²	Ar
S	O	CH ₃	CH ₂ -CH=CH ₂	
S	O	CH ₃	CH ₂ -C≡CH	
S	O	CH ₃	CHF ₂	
S	O	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
S	O	CH ₃	CH ₂ F	

A	Q		R ²		
S	O	CH ₃	CF ₃		5 10 15
S	O	CH ₃	CH ₃		20 25
S	O	CH ₃	C ₂ H ₅		30 35
S	O	CH ₃	CH ₂ -CH=CH ₂		40 45
S	O	CH ₃	CH ₂ -C≡CH		50 55
S	O	CH ₃	CHF ₂		60 65

A	Q	R	R ²	Ar
S	O	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
S	O	CH ₃	CH ₂ F	
S	O	CH ₃	CF ₃	

Verwendet man beispielsweise 4-(4-Chlor-2-fluor-5-methoxy-phenyl)-2-methyl-thiosemicarbazid und Phosgen als Ausgangsstoffe sowie Chlordifluormethan in der Folgestufe als Alkylierungsmittel, so kann der Reaktionsablauf beim erfindungsgemäßen Verfahren durch das folgende Formelschema skizziert werden:



Die beim erfindungsgemäßen Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als Ausgangsstoffe zu verwendenden Aryliminoverbindungen sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In der Formel (II) haben A, R, R² und Ar vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für A, R, R² und Ar angegeben wurden.

Die Ausgangsstoffe der Formel (II) sind bekannt und/oder können nach bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. EP-A 258182, US-P 4721522, DE-A 37 22 074, US-P 5108486, Herstellungsbeispiele).

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) weiter als Ausgangsstoffe zu verwendenden reaktiven Kohlensäurederivate sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In der Formel (III) hat Q vorzugsweise bzw. insbesondere diejenige Bedeutung, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für Q angegeben wurde; X steht vorzugsweise für Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkoxy, Phenoxy oder Benzyloxy, insbesondere für Chlor, Methoxy oder Phenoxy.

Die Ausgangsstoffe der Formel (III) sind bekannte Syntheschemikalien.

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) gegebenenfalls weiter als Ausgangsstoffe zu verwendenden Alkylierungsmittel sind durch die Formel (IV) allgemein definiert. In der Formel (IV) hat R² vorzugsweise bzw. insbesondere diejenige Bedeutung, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt bzw. als insbeson-

dere bevorzugt fuhr R^2 angegeben wurde; X^1 steht vorzugsweise für Chlor, Brom oder die Gruppierung $-O-SO_2-O-R^2$.

Die Ausgangsstoffe der Formel (IV) sind bekannte Syntheschemikalien.

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens kommen die üblichen organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören insbesondere aliphatische, alicyclische oder aromatische, gegebenenfalls halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Benzin, Benzol, Toluol, Xylol, Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Petrolether, Hexan, Cyclohexan, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Dioxan, Tetrahydrofuran oder Ethylenglykoldimethyl- oder -diethylether; Ketone, wie Aceton, Butanon oder Methyl-isobutyl-keton; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester, Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid, Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n- oder i-Propanol, Ethylenglykolmonomethylether, Ethylenglykolmonoethylether, Diethylenglykolmonomethylether, Diethylenglykolmonoethylether, deren Gemische mit Wasser oder reines Wasser.

Das erfindungsgemäße Verfahren wird vorzugsweise in Gegenwart eines geeigneten Reaktionshilfsmittels durchgeführt. Als solche kommen alle üblichen anorganischen oder organischen Basen in Frage. Hierzu gehören beispielsweise Alkalimetall- oder Erdalkalimetall-, -hydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie beispielsweise Lithium-, Natrium-, Kalium- oder Calciumhydrid, Lithium-, Natrium- oder Kalium-amid, Natrium- oder Kalium-methylat, Natrium- oder Kalium-ethylat, Natrium- oder Kalium-propylat, Aluminiumisopropylat, Natrium- oder Kalium-tert-butylat, Natrium- oder Kalium-hydroxid, Ammoniumhydroxid, Natrium-, Kalium- oder Calcium-acetat, Ammoniumacetat, Natrium-, Kalium- oder Calcium-carbonat, Ammoniumcarbonat, Natrium- oder Kalium-hydrogencarbonat, sowie basische organische Stickstoffverbindungen, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tripropylamin, Tributylamin, Ethyl-diisopropylamin, N,N-Dimethylcyclohexylamin, Dicyclohexylamin, Ethyl-dicyclohexylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, 2-Methyl-, 3-Methyl- und 4-Methylpyridin, 2,4-Dimethyl-, 2,6-Dimethyl-, 3,4-Dimethyl- und 3,5-Dimethyl-pyridin, 5-Ethyl-2-methyl-pyridin, N-Methylpiperidin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen -10°C und $+150^\circ\text{C}$, vorzugsweise bei Temperaturen zwischen 0°C und 100°C , insbesondere bei Temperaturen zwischen 10°C und 80°C .

Das erfindungsgemäße Verfahren wird im allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt. Es ist jedoch auch möglich, unter erhöhtem oder vermindertem Druck — im allgemeinen zwischen 0,1 bar und 10 bar — zu arbeiten.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens werden die jeweils benötigten Ausgangsstoffe im allgemeinen in angenähert äquimolaren Mengen eingesetzt. Es ist jedoch auch möglich, eine der beiden jeweils eingesetzten Komponenten in einem größeren Überschuß zu verwenden. Die Reaktionen werden im allgemeinen in einem geeigneten Verdünnungsmittel gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels durchgeführt, und das Reaktionsgemisch wird mehrere Stunden bei der jeweils erforderlichen Temperatur gerührt. Die Aufarbeitung erfolgt bei dem erfindungsgemäßen Verfahren jeweils nach üblichen Methoden (vgl. die Herstellungsbeispiele).

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als Defolianten, Desiccants, Krautabtötungsmittel und insbesondere als Unkrautvernichtungsmittel verwendet werden. Unter Unkraut im weitesten Sinne sind alle Pflanzen zu verstehen, die an Orten aufwachsen, wo sie unerwünscht sind. Ob die erfindungsgemäßen Stoffe als totale oder selektive Herbizide wirken, hängt im wesentlichen von der angewandten Menge ab.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können z. B. bei den folgenden Pflanzen verwendet werden:

Dikotyle Unkräuter der Gattungen: Sinapis, Lepidium, Galium, Stellaria, Matricaria, Anthemis, Galinsoga, Chenopodium, Urtica, Senecio, Amaranthus, Portulaca, Xanthium, Convolvulus, Ipomoea, Polygonum, Sesbania, Ambrosia, Cirsium, Carduus, Sonchus, Solanum, Rorippa, Rotala, Lindernia, Lamium, Veronica, Abutilon, Emex, Datura, Viola, Galeopsis, Papaver, Centaurea, Trifolium, Ranunculus, Taraxacum.

Dikotyle Kulturen der Gattungen: Gossypium, Glycine, Beta, Daucus, Phaseolus, Pisum, Solanum, Linum, Ipomoea, Vicia, Nicotiana, Lycopersicon, Arachis, Brassica, Lactuca, Cucumis, Cucurbita.

Monokotyle Unkräuter der Gattungen: Echinochloa, Setaria, Panicum, Digitaria, Phleum, Poa, Festuca, Eleusine, Brachiaria, Lolium, Bromus, Avena, Cyperus, Sorghum, Agropyron, Cynodon, Monochoria, Fimbristylis, Sagittaria, Eleocharis, Scirpus, Paspalum, Ischaemum, Sphenoclea, Dactyloctenium, Agrostis, Alopecurus, Apera.

Monokotyle Kulturen der Gattungen: Oryza, Zea, Triticum, Hordeum, Avena, Secale, Sorghum, Panicum, Saccharum, Ananas, Asparagus, Allium.

Die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe ist jedoch keineswegs auf diese Gattungen beschränkt, sondern erstreckt sich in gleicher Weise auch auf andere Pflanzen.

Die Verbindungen eignen sich in Abhängigkeit von der Konzentration zur Totalunkrautbekämpfung z. B. auf Industrie- und Gleisanlagen und auf Wegen und Plätzen mit und ohne Baumbewuchs. Ebenso können die Verbindungen zur Unkrautbekämpfung in Dauerkulturen, z. B. Forst, Ziergehölz-, Obst-, Wein-, Citrus-, Nuß-, Bananen-, Kaffee-, Tee-, Gummi-, Ölpalm-, Kakao-, Beerenfrucht- und Hopfenanlagen, auf Zier- und Sportrasen und Weideflächen und zur selektiven Unkrautbekämpfung in einjährigen Kulturen eingesetzt werden.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) eignen sich insbesondere zur selektiven Bekämpfung von monokotylen und dikotylen Unkräutern in monokotylen und dikotylen Kulturen sowohl im Voraufbau- als auch im Nachaufbau-Verfahren.

Die Wirkstoffe können in die üblichen Formulierungen übergeführt werden, wie Lösungen, Emulsionen,

Spritzpulver, Suspensionen, Pulver, Stäubemittel, Pasten, lösliche Pulver, Granulate, Suspensions-Emulsions-Konzentrate, Wirkstoff-...-ierte Natur- und synthetische Stoffe sowie ...stverkapselungen in polymeren Stoffen.

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z. B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergierrmitteln und/oder schaumergezeugenden Mitteln.

Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z. B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol, oder Alkyl-naphthaline, chlorierte Aromaten und chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z. B. Erdölfraktionen, mineralische und pflanzliche Öle, Alkohole, wie Butanol oder Glykol sowie deren Ether und Ester, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser.

Als feste Trägerstoffe kommen in Frage:

z. B. Ammoniumsalze und natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate, als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z. B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnußschalen, Maiskolben und Tabakstengeln; als Emulgier- und/oder schaumergezeugende Mittel kommen in Frage: z. B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäure-Ester, Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, z. B. Alkylaryl-polyglykolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate; als Dispergierrmittel kommen in Frage: z. B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulvrige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Cephaline und Lecithine und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z. B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyaninfarbstoffe und Spurennährstoffe wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90%.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Herbiziden zur Unkrautbekämpfung Verwendung finden, wobei Fertigformulierungen oder Tankmischungen möglich sind.

Für die Mischungen kommen bekannte Herbizide in Frage, beispielsweise Anilide, wie z. B. Diflufenican und Propanil; Arylcarbonsäuren, wie z. B. Dichlorpicolinsäure, Dicamba und Picloram; Aryloxyalkansäuren, wie z. B. 2,4 D, 2,4 DB, 2,4 DP, Fluroxypyr, MCPA, MCPP und Triclopyr; Aryloxy-phenoxy-alkansäureester, wie z. B. Diclofop-methyl, Fenoxaprop-ethyl, Fluazifop-butyl, Haloxypop-methyl und Quizalofopethyl; Azinone, wie z. B. Chloridazon und Norflurazon; Carbamate, wie z. B. Chlorpropham, Desmedipham, Phenmedipham und Propham; Chloracetanilide, wie z. B. Alachlor, Acetochlor, Butachlor, Metazachlor, Metolachlor, Pretilachlor und Propachlor; Dinitroaniline, wie z. B. Oryzalin, Pendimethalin und Trifluralin; Diphenylether, wie z. B. Acifluorfen, Bifenox, Fluoroglycofen, Fomesafen, Halosafen, Lactofen und Oxyfluorfen; Harnstoffe, wie z. B. Chlortoluron, Diuron, Fluometuron, Isoproturon, Linuron und Methabenzthiazuron; Hydroxylamine, wie z. B. Alloxydim, Clethodim, Cycloxydim, Sethoxydim und Tralkoxydim; Imidazolinone, wie z. B. Imazethapyr, Imazamethabenz, Imazapyr und Imazaquin; Nitrile, wie z. B. Bromoxynil, Dichlobenil und Ioxynil; Oxyacetamide, wie z. B. Mefenacet; Sulfonylharnstoffe, wie z. B. Amidosulfuron, Bensulfuron-methyl, Chlorimuron-ethyl, Chlorsulfuron, Cinosulfuron, Metsulfuron-methyl, Nicosulfuron, Primisulfuron, Pyrazosulfuron-ethyl, Thifensulfuronmethyl, Triasulfuron und Tribenuron-methyl; Thiolcarbamate, wie z. B. Butylate, Cycloate, Diallate, EPTC, Esprocarb, Molinate, Prosulfocarb, Thiobencarb und Triallate; Triazine, wie z. B. Atrazin, Cyanazin, Simazin, Simetryne, Terbutryne und Terbutylazin; Triazinone, wie z. B. Hexazinon, Metamitron und Metribuzin; Sonstige, wie z. B. Aminotriazol, Benfuresate, Bentazone, Cinmethylin, Clomazone, Clopyralid, Difenzoquat, Dithiopyr, Ethofumesate, Fluorchloridone, Glufosinate, Glyphosate, Isoxaben, Pyridate, Quinchlorac, Quinmerac, Sulphosate und Tridiphane.

Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Fungiziden, Insektiziden, Akariziden, Nematiziden, Schutzstoffen gegen Vogelfraß, Pflanzennährstoffen und Bodenstrukturverbesserungsmitteln ist möglich.

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus durch weiteres Verdünnen bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Emulsionen, Pulver, Pasten und Granulate angewandt werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z. B. durch Gießen, Spritzen, Sprühen, Streuen.

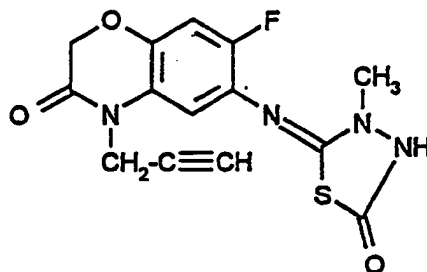
Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können sowohl vor als auch nach dem Auflaufen der Pflanzen appliziert werden. Sie können auch vor der Saat in den Boden eingearbeitet werden.

Die angewandte Wirkstoffmenge kann in einem größeren Bereich schwanken. Sie hängt im wesentlichen von der Art des gewünschten Effektes ab. Im allgemeinen liegen die Aufwandmengen zwischen 10 g und 10 kg Wirkstoff pro Hektar Bodenfläche, vorzugsweise zwischen 50 g und 5 kg pro ha.

Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geht aus den nachfolgenden Beispielen hervor.

Herstellungsbeispiele

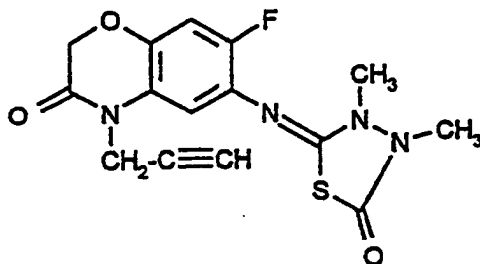
Beispiel 1



Zu einer Suspension von 3,1 g (10 mMol) 2-Methyl-4-(7-fluor-3,4-dihydro-3-oxo-4-propargyl-(2H)-1,4-benzoxazin-6-yl)-thiosemicarbazid in 50 ml Dichlormethan gibt man bei ca. 20°C 6 g (12 mMol) einer 20%igen Lösung von Phosgen in Toluol. Man erwärmt die Reaktionsmischung ca. 15 Stunden auf 40°C, entfernt das Lösungsmittel im Vakuum und nimmt den Rückstand in Wasser auf. Man neutralisiert mit Natriumbicarbonatlösung, filtriert den Feststoff, wäscht mit Wasser und trocknet im Vakuum bei 40–50°C.

Man erhält 2,8 g (84% der Theorie) 2-(7-Fluor-3,4-dihydro-3-oxo-4-propargyl-(2H)-1,4-benzoxazin-6-yl-imino)-3-methyl-3,4-dihydro-5-oxo-(4H)-1,3,4-thiadiazol. Schmelzpunkt: 214°C.

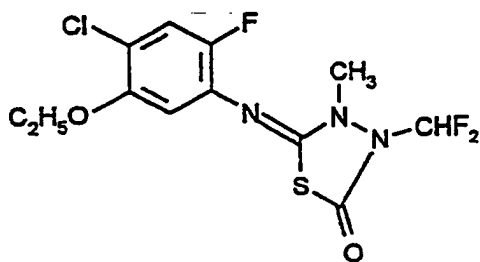
Beispiel 2



Zu einer Mischung aus 1,7 g (5 mMol) 2-(7-Fluoro-3,4-dihydro-3-oxo-4-propargyl-(2H)-1,4-benzoxazin-6-yl-imino)-3-methyl-3,4-dihydro-5-oxo-(4H)-1,3,4-thiadiazol, 1,4 g (10 mMol) Kaliumcarbonat und 50 ml Acetonitril gibt man 1,1 g (7,5 mMol) Methyljodid. Die Reaktionsmischung wird 5 Stunden auf 40°C erwärmt. Das Lösungsmittel wird im Vakuum entfernt, der Rückstand in Wasser aufgenommen, neutralisiert und mit Dichlormethan extrahiert. Die organische Phase wird über Magnesiumsulfat getrocknet, aufkonzentriert und chromatographisch gereinigt (Laufmittel: Dichlormethan/Methanol: 40 : 1).

Man erhält 0,75 g (42% der Theorie) 3,4-Dimethyl-2-(7-fluoro-3,4-dihydro-3-oxo-4-propargyl-(2H)-1,4-benzoxazin-6-yl-imino)-3,4-dihydro-5-oxo-1,3,4-thiadiazol. Schmelzpunkt: 104°C.

Beispiel 3

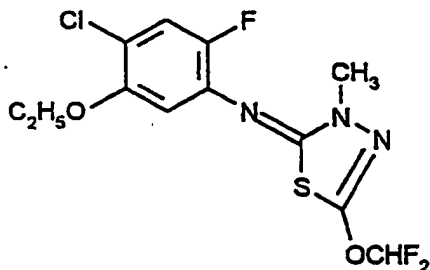


Zu einer Lösung aus 3,3 g (11 mMol) 2-(4-Chlor-2-fluor-5-ethoxy-phenyl-imino)-3-methyl-3,4-dihydro-5-oxo-(4H)-1,3,4-thiadiazol in 80 ml Dimethylformamid gibt man 3,4 g (24 mMol) Kaliumcarbonat und leitet bei 60°C

innerhalb von 6 Stunden in einem Chlordifluormethan ein. Nach beendeter Reaktion wird die Hauptmenge des Lösungsmittels im Vakuum entfernt. Der ölige Rückstand wird in Wasser aufgenommen, mit Salzsäure neutralisiert und mit Dichlormethan extrahiert. Die organische Phase wird über Magnesiumsulfat getrocknet, aufkonzentriert und chromatographisch mit Dichlormethan als Laufmittel getrennt.

Als erste Fraktion erhält man 0,4 g 2-(4-Chlor-2-fluor-5-ethoxyphenylimino)-4-difluormethyl-3-methyl-3,4-dihydro-5-oxo-1,3,4-thiadiazol. Schmelzpunkt: 121°C.

Als zweite Fraktion erhält man 0,5 g 2-(4-Chlor-2-fluor-5-ethoxyphenylimino)-3-methyl-5-difluormethoxy-1,3,4-thiadiazol. Schmelzpunkt: 42°C.

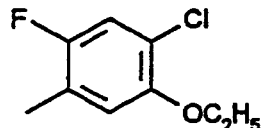
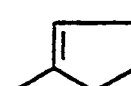
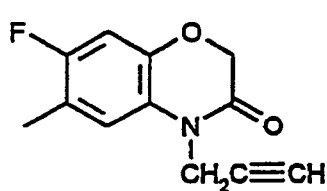
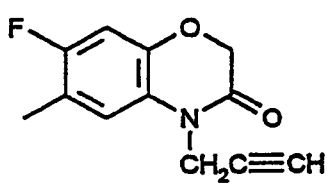
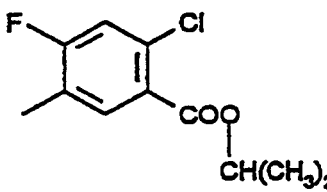
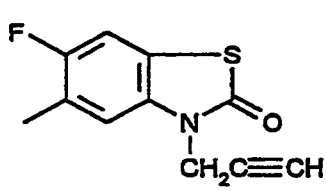
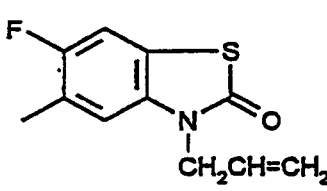


Analog zu den Beispielen 1 bis 3 sowie entsprechend der allgemeinen Beschreibung des erfindungsgemäßen Herstellungsverfahrens können beispielsweise auch die in der nachstehenden Tabelle 1 aufgeführten Verbindungen der Formel (I) — bzw. der Formeln (IA) und (IB) — hergestellt werden.

Tabelle 1

Beispiele für die Verbindungen der Formel (I)

Bsp.- Nr.	allg. Formel	Ar	R	R ²	Q	A	Schmelz- punkt (°C)
4	IA		CH ₃	CH ₃	O	S	118
5	IA		CH ₃	C ₂ H ₅	O	S	95
6	IA		CH ₃	CH ₃	O	S	103
7	IA		CH ₃	CN	O	S	60
8	IA		CH ₃	C ₂ H ₅	O	S	117

Bsp.- Nr.	allg. For- mel		R	R ²		A	Schmelz- punkt (°C)	
9	IA		CH ₃		O	S	95	5
10	IA		CH ₃	-CH ₂ C≡CH	O	S	147	10
11	IA		CH ₃	-CH ₂ CH=CH ₂	O	S	119	15
12	IA		CH ₃	CH ₃	O	S	72	20
13	IA		CH ₃	CH ₃	O	S	121	25
14	IA		CH ₃	CH ₃	O	S	54	30
								35
								40
								45
								50
								55
								60
								65

Bsp.- Nr.	allg. For- mel	Ar	R	R ²	Q	A	Schmelz- punkt (°C)
--------------	----------------------	----	---	----------------	---	---	---------------------------

15	IA		CH ₃	CH ₃	O	S	156
----	----	---	-----------------	-----------------	---	---	-----

16	IA		CH ₃	CH ₃	O	S	(Öl)
----	----	---	-----------------	-----------------	---	---	------

17	IA		CH ₃	CHF ₂	O	S	
----	----	---	-----------------	------------------	---	---	--

18	IA		CH ₃	CH ₃	O	S	(amorph)
----	----	--	-----------------	-----------------	---	---	----------

19	IA		CH ₃	CH ₃	O	S	68
----	----	---	-----------------	-----------------	---	---	----

20	IA		CH ₃	CHF ₂	O	S	
----	----	---	-----------------	------------------	---	---	--

Bsp.- Nr.	allg. For- mel		R	R ²		A	Schmelz- punkt (°C)	5
21	IB		CH ₃	CH ₃	O	S	64	10
22	IB		CH ₃	CH ₃	O	S	105	15
23	IA		CH ₃	H	O	S	248	20
24	IA		CH ₃	H	O	S	137	25
25	IA		CH ₃	H	O	S	67	30
26	IA		CH ₃	H	O	S	(Öl)	35
								40
								45
								50
								55
								60
								65

Bsp.- Nr.	allg. For- mel	Ar	R	R ²	Q	A	Schmelz- punkt (°C)
--------------	----------------------	----	---	----------------	---	---	---------------------------

27	IA		CH ₃	H	O	S	194
----	----	--	-----------------	---	---	---	-----

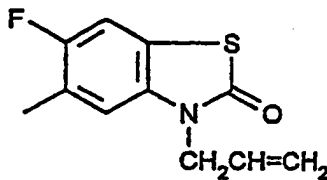
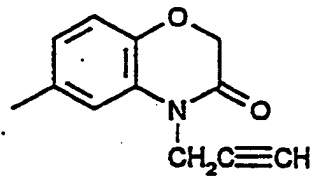
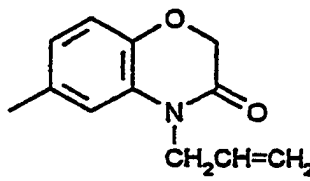
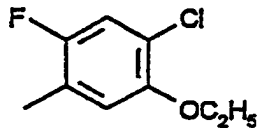
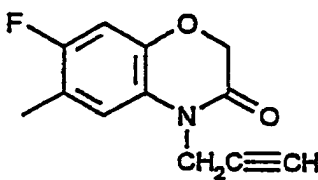
28	IA		CH ₃	H	O	S	(Öl)
----	----	--	-----------------	---	---	---	------

29	IA		CH ₃	H	O	S	72
----	----	--	-----------------	---	---	---	----

30	IA		CH ₃	H	O	S	161
----	----	--	-----------------	---	---	---	-----

31	IA		CH ₃	H	O	S	115
----	----	--	-----------------	---	---	---	-----

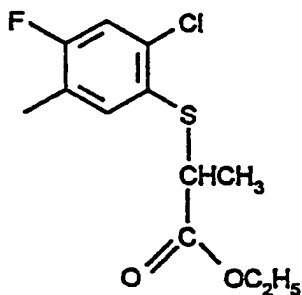
32	IA		CH ₃	H	O	S	70
----	----	--	-----------------	---	---	---	----

Bsp.- Nr.	allg. For- mel		R	R ²		A	Schmelz- punkt (°C)	
33	IA		CH ₃	H	O	S	134	5
								10
								15
34	IA		CH ₃	H	O	S	158	20
								25
35	IA		CH ₃	H	O	S	144	30
								35
36	IB		CH ₃	C ₂ H ₅	O	S	97	40
								45
37	IB		CH ₃	CHF ₂	O	S	119	50
								55
								60
								65

Bsp.- Nr.	allg. For- mel	Ar	R	R ²	Q	A	Schmelz- punkt (°C)
--------------	----------------------	----	---	----------------	---	---	---------------------------

38

IA

CH₃CH₃

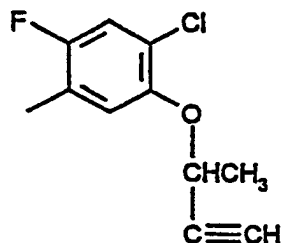
O

S

(amorph)

39

IA

CH₃CH₃

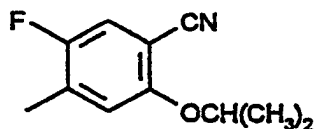
O

S

125

40

IA

CH₃CH₃

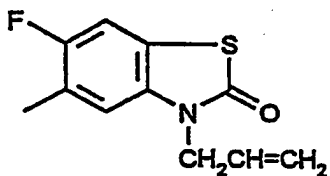
O

S

72

41

IB

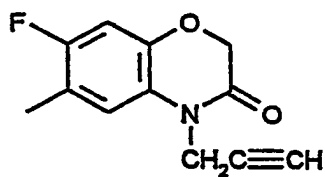
CH₃CHF₂

O

S

42

IA

C₂H₅C₂H₅

O

S

137

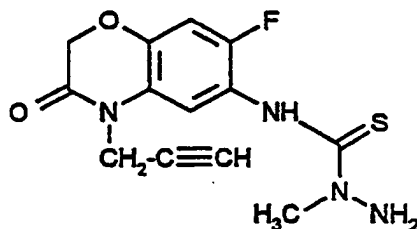
Bsp.- Nr.	allg. For- mel		R	R ²	A	Schmelz- punkt (°C)	
--------------	----------------------	--	---	----------------	---	---------------------------	--

43	IA		CH ₃	CHF ₂	O S		5
----	----	---	-----------------	------------------	-----	--	---

44	IB		CH ₃	CHF ₂	O S		10
----	----	---	-----------------	------------------	-----	--	----

Ausgangsstoffe der Formel (II)

Beispiel (II-1)



1. Stufe

Zu einer Mischung aus 12 g (0,12 Mol) Calciumcarbonat, 150 ml Wasser, 13,7 g (0,12 Mol) Thiophosgen und 100 ml Dichlormethan gibt man unter Rühren 26,4 g (0,12 Mol) 6-Amino-7-fluoro-3,4-dihydro-3-oxo-4-propargyl-(2H)-1,4-benzoxazin in 50 ml Dichlormethan. Das Reaktionsgemisch wird ca. 3 Stunden bei 35°C bis 40°C gerührt. Dann wird nach Filtration die organische Phase abgetrennt, mit Magnesiumsulfat getrocknet und filtriert. Das Filtrat wird im Vakuum vom Lösungsmittel befreit.

Man erhält 27 g (85,9% der Theorie) 6-Isothiocyanato-7-fluor-3,4-dihydro-3-oxo-4-propargyl-(2H)-1,4-benzoxazin.

Schmelzpunkt: 128°C.

2. Stufe

Zu einer Lösung von 5,24 g (20 mMol) 6-Isothiocyanato-7-fluoro-3,4-dihydro-3-oxo-4-propargyl-(2H)-1,4-benzoxazin in 60 ml Tetrahydrofuran gibt man bei 5°C bis 10°C 0,92 g (20 mMol) Methylhydrazin. Nach zweistündigem Rühren bei 10°C wird das Lösungsmittel im Vakuum abgezogen und der feste Rückstand aus iso-Propanol umkristallisiert.

Man erhält 4,7 g (76,3% der Theorie) 2-Methyl-4-(7-fluoro-3,4-dihydro-3-oxo-4-propargyl-(2H)-1,4-benzoxazin-6-yl)-thiosemicarbazid.

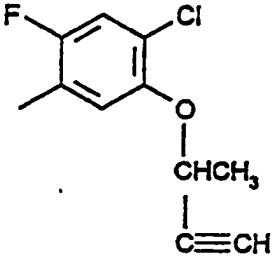
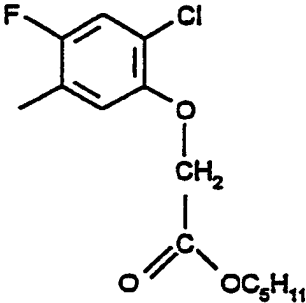
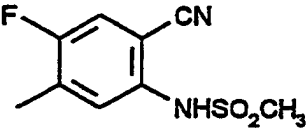
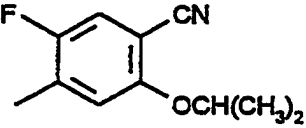
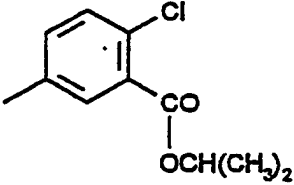
Schmelzpunkt: 162°C.

Analog Beispiel (II-1) können beispielsweise auch die in der nachstehenden Tabelle 2 aufgeführten Verbindungen der Formel (II) — und/oder Tautomere hiervon — hergestellt werden.

Tabelle 2

Beispiele für die Verbindungen der Formel (II)

Bsp.- Nr.	Ar	R	R ²	A	Schmelz- punkt (°C)
II-2		CH ₃	H	S	173
II-3		CH ₃	H	S	154
II-4		CH ₃	H	S	125
II-5		CH ₃	H	S	(Öl)

Bsp.- Nr.		R	R ²	A	Schmelz- punkt (°C)	
II-6		CH ₃	H	S	154	5
II-7		CH ₃	H	S	111	10
II-8		CH ₃	H	S	187	15
II-9		CH ₃	H	S	166	20
II-10		CH ₃	H	S	116	25
						30
						35
						40
						45
						50
						55
						60
						65

Bsp.-
Nr.

Ar

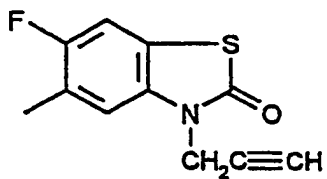
R

R²

A

Schmelz-
punkt (°C)

II-11

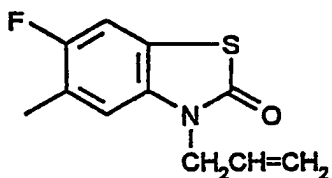
CH₃

H

S

157

II-12

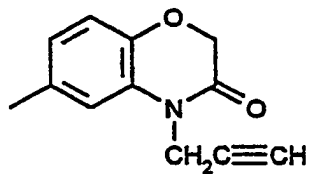
CH₃

H

S

161

II-13

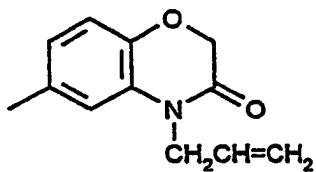
CH₃

H

S

152

II-14

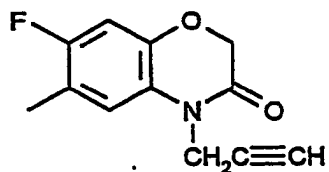
CH₃

H

S

118

II-15



H

H

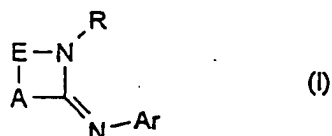
S

164

Claims

DE 44 24 787 A1

1. Substituted arylimino heterocycles of general formula (I)



in which

A stands for oxygen, sulfur or the grouping N-R¹,
with R¹ standing for hydrogen or for alkyl, alkenyl or alkynyl, each optionally substituted,

E stands for one of the following groupings



with Q standing for oxygen, sulfur or the grouping N-R¹ (R¹ having the meaning given above) and

R² standing for hydrogen, cyano or for alkyl, alkenyl, alkynyl, cycloalkyl or cycloalkenyl, each optionally substituted,

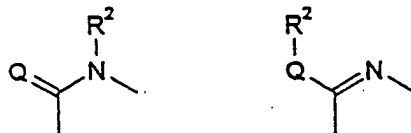
R stands for hydrogen or for alkyl, alkenyl or alkynyl, each optionally substituted, and

Ar stands for monocyclic or bicyclic aryl or heteroaryl each optionally substituted.

2. Substituted arylamino heterocycles of general formula (I) according to Claim 1, characterized in that

A stands for oxygen, sulfur or the grouping N-R¹,
with R¹ standing for hydrogen or for alkyl with 1 to 6 carbon atoms optionally substituted by cyano, halogen, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ alkyl carbonyl or C₁-C₄ alkoxy carbonyl or for alkenyl or alkynyl each with 2 to 6 carbon atoms, each optionally substituted by halogen,

E stands for one of the following groupings



with Q standing for oxygen, sulfur or the grouping N-R¹ (R¹ having the meaning given above as preferred), and



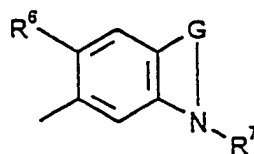
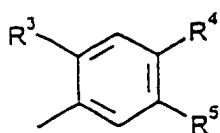
1

2

R^2 standing for hydrogen, cyano or for alkyl with 1 to 6 carbon atoms optionally substituted by cyano, halogen, C_1 - C_4 alkoxy, C_1 - C_4 alkyl carbonyl or C_1 - C_4 alkoxy carbonyl or for alkenyl or alkynyl each with 2 to 6 carbon atoms, each optionally substituted by halogen or for cycloalkyl with 3 to 6 carbon atoms or cycloalkenyl with 5 or 6 carbon atoms, each optionally substituted by halogen or C_1 - C_4 alkyl.

R stands for hydrogen or for alkyl with 1 to 6 carbon atoms optionally substituted by cyano, halogen, C_1 - C_4 alkoxy, C_1 - C_4 alkyl carbonyl or C_1 - C_4 alkoxy carbonyl or for alkenyl or alkynyl each with 2 to 6 carbon atoms each optionally substituted by halogen, and

Ar stands for one of the following optionally substituted monocyclic or bicyclic aryl or heteroaryl groupings,



in which

R^3 stands for hydrogen or halogen,

R^4 stands for hydrogen, cyano, nitro, thiocarbamoyl, halogen or for C_1 - C_4 alkyl or C_1 - C_4 alkoxy, each optionally substituted by halogen,

R^5 stands for the following groupings,

$-A^1-A^2-A^3$

in which

A^1 stands for a single bond, for oxygen, sulfur, $-SO-$, $-SO_2-$, $-CO-$ or the grouping $-N-A^4-$, with A^4 standing for hydrogen, hydroxy, C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 alkoxy, phenyl, C_1 - C_4 alkyl sulfonyl or phenyl sulfonyl, or

A^1 further stands for C_1 - C_6 alkandiyl, C_2 - C_6 alkendiyl, C_2 - C_6 azaalkendiyl, C_2 - C_6 alkindiyl, C_3 - C_6 cycloalkandiyl, C_3 - C_6 cycloalkendiyl or phenylene, each optionally substituted by fluorine, chlorine or bromine,

A^2 stands for a single bond, for oxygen, sulfur, $-SO-$, $-SO_2-$, $-CO-$ or the grouping $-N-A^4-$, with A^4 standing for hydrogen, hydroxy, C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 alkoxy, phenyl, C_1 - C_4 alkyl sulfonyl or phenyl sulfonyl, or

A^2 further stands for C_1 - C_6 alkandiyl, C_2 - C_6 alkendiyl, C_2 - C_6 azaalkendiyl, C_2 - C_6 alkindiyl, C_3 - C_6 cycloalkandiyl, C_3 - C_6 cycloalkendiyl or phenylene, each optionally substituted by fluorine, chlorine or bromine,

A^3 stands for hydrogen, hydroxy, amino, cyano, isocyano, thiocyanato, nitro, carboxy, carbamoyl, thiocarbamoyl, sulfo, chlorosulfonyl, halogen, for alkyl, alkoxy, alkylthio,



alkylsulfinyl, alkylsulfonyl, alkylamino, dialkylamino, alkoxycarbonyl or dialkoxy-(thio)phosphoryl each with 1 to 6 carbon atoms in the alkyl groups, each optionally substituted by halogen or C₁-C₄ alkoxy, for alkenyl, alkenyloxy, alkenylamino, alkenyloxycarbonyl, alkynyl, alkynyloxy, alkynylamino or alkynyloxycarbonyl each with 2 to 6 carbon atoms in the alkenyl, alkylidene or alkynyl groups, each optionally substituted by halogen, for cycloalkyl, cycloalkoxy, cycloalkylalkyl, cycloalkylalkyloxy, cycloalkylidene amino, cycloalkyloxycarbonyl or cycloalkylalkyloxycarbonyl each with 3 to 6 carbon atoms in the cycloalkyl groups and optionally 1 to 4 carbon atoms in the alkyl groups, each optionally substituted by halogen, cyano, carboxy, C₁-C₄ alkyl and/or C₁-C₄ alkoxycarbonyl, or for phenyl, phenyloxy, phenyl-C₁-C₄ alkyl, phenyl-C₁-C₄ alkoxy, phenyloxycarbonyl or phenyl-C₁-C₄ alkoxycarbonyl, (each partially or completely optionally hydrated) pyrrolyl, pyrazolyl, imidazolyl, triazolyl, furyl, thienyl, oxazolyl, isoxazolyl, thiazolyl, isothiazolyl, oxadiazolyl, thiadiazolyl, pyridinyl, pyrimidinyl, triazinyl, pyrazolyl, pyrazolyl-C₁-C₄ alkyl, furyl-C₁-C₄ alkyl, thienyl-C₁-C₄ alkyl, oxazolyl-C₁-C₄ alkyl, isoxazole-C₁-C₄ alkyl, thiazole-C₁-C₄ alkyl, pyridinyl-C₁-C₄ alkyl, pyrimidinyl-C₁-C₄ alkyl, pyrazolylmethoxy, furylmethoxy, each optionally substituted by nitro, cyano, carboxy, halogen C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ halogenalkyl, C₁-C₄ alkyloxy, C₁-C₄ halogenalkyloxy and/or C₁-C₄ alkoxycarbonyl, or for perhydropyranylmethoxy or pyridylmethoxy,

R⁶ stands for hydrogen or halogen,

R⁷ stands for hydrogen, hydroxy, for alkyl with 1 to 6 carbon atoms optionally substituted by cyano, halogen, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ alkyl carbonyl or C₁-C₄ alkoxy carbonyl, for alkenyl or alkynyl each with 2 to 6 carbon atoms, each optionally substituted by halogen, for cycloalkyl or cycloalkylalkyl each with 3 to 6 carbon atoms in the cycloalkyl part and optionally 1 to 4 carbon atoms in the alkyl part, each optionally substituted by halogen or C₁-C₄ alkyl, for alkoxy or alkenyloxy each with up to 6 carbon atoms, each optionally substituted by halogen, or for benzyl or benzyloxy optionally substituted by cyano, halogen, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ halogen alkyl, C₁-C₄ alkoxy or C₁-C₄ halogen alkoxy, and

G stands for one of the following groupings,

-O-CO-, -S-CO-, -O-C(R⁸,R⁹)-CO-, -C(R⁸,R⁹)-O-CO-, -C(R⁸,R⁹)-, -C(R⁸,R⁹)-C(R⁸,R⁹)-CO-, -C(R⁸)=C(R⁸)-, -C(R⁸)=C(R⁸)-CO-, -C(R⁸,R⁹)-CO-, -N(R¹⁰)-C(R⁸,R⁹)-CO-, -C(R⁸)=N-, -O-CO-C(R⁸,R⁹)-

with

R⁸ and R⁹ being the same or different and individually standing for hydrogen or alkyl with 1 to 6 carbon atoms or together standing for alkandiyl with 2 to 6 carbon atoms, and R¹⁰ standing for hydrogen or alkyl with 1 to 6 carbon atoms.

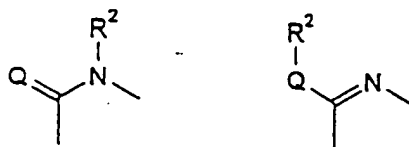
3. Substituted aryliminoheterocycles of general formula (I) according to Claim 1, characterized in that

A stands for hydrogen, sulfur or the grouping N-R¹,

with R¹ standing for hydrogen or for methyl, ethyl, n- or i-propyl, n-, i-, s- or t-butyl each optionally substituted by cyano, fluorine, chlorine, methoxy, ethoxy, acetyl, propionyl, methoxycarbonyl or ethoxycarbonyl, or for propenyl, butenyl, propinyl or butinyl each optionally substituted by fluorine, chlorine or bromine,

E stands for one of the following groupings,





with Q standing for oxygen, sulfur or the grouping N-R¹ (R¹ having the meaning given above as especially preferred), and
 R² standing for hydrogen, cyano or for methyl, ethyl, n- or i- propyl, n-, i-, s- or t-butyl each optionally substituted by cyano, fluorine, chlorine, methoxy, ethoxy, acetyl, propionyl, methoxycarbonyl or ethoxycarbonyl, or for propenyl, butenyl, propinyl or butinyl each optionally substituted by fluorine, chlorine or bromine, or for cyclopentenyl or cyclohexenyl,

R stands for hydrogen or for methyl, ethyl, n- or i- propyl, n-, i-, s- or t-butyl each optionally substituted by cyano, fluorine, chlorine, methoxy, ethoxy, acetyl, propionyl, methoxycarbonyl or ethoxycarbonyl, or for propenyl, butenyl, propinyl or butinyl each optionally substituted by fluorine, chlorine or bromine,

Ar stands for one of the following optionally substituted monocyclic or bicyclic aryl or heteroaryl groupings,

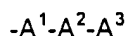


in which

R³ stands for hydrogen, fluorine or chlorine,

R⁴ stands for hydrogen, cyano, chlorine, bromine, methyl or trifluoromethyl,

R⁵ stands for the following grouping,



in which

A¹ stands for a single bond, for oxygen, sulfur, -SO-, -SO₂-, -CO- or the grouping -N-A⁴-, with A⁴ standing for hydrogen, hydroxy, methyl, ethyl, n- or i-propyl, methoxy, ethoxy, n- or i-propoxy, methylsulfonyl or ethylsulfonyl, or

A¹ further stands for methylene, ethane-1,1-diyl, ethane-1,2-diyl, propane-1,1-diyl, propane-1,2-diyl, propane-1,3-diyl, ethene-1,2-diyl, propene-1,2-diyl, propene-1,3-diyl, ethine-1,2-diyl or propine-1,3-diyl,

A² stands for a single bond, for oxygen, sulfur, -SO-, -SO₂-, -CO- or the grouping -N-A⁴-, with A⁴ standing for hydrogen, hydroxy, methyl, ethyl, n- or i-propyl, methoxy, ethoxy, n- or i-propoxy, methylsulfonyl or ethylsulfonyl, n- or i-propylsulfonyl or phenylsulfonyl, or



A² further stands for methylene, ethane-1,1-diyl, ethane-1,2-diyl, propane-1,1-diyl, propane-1,2-diyl, propane-1,3-diyl, ethene-1,2-diyl, propene-1,2-diyl, propene-1,3-diyl, ethine-1,2-diyl or propine-1,3-diyl,

A³ stands for hydrogen, hydroxy, amino, cyano, nitro, carboxy, carbamoyl, sulfo, fluorine, chlorine, bromine, for methyl, ethyl, n- or i-propyl, n-, i-, s- or t-butyl, n-, i-, s- or t-pentyl, methoxy, ethoxy, n- or i-propoxy, n-, i-, s- or t-butoxy, n-, i-, s- or t-pentyloxy, methylthio, ethylthio, n- or i-propylthio, n-, i-, s- or t-butylthio, methylsulfinyl, ethylsulfinyl, n- or i-propylsulfinyl, methylsulfonyl, ethylsulfonyl, n- or i-propylsulfonyl, methylamino, ethylamino, n- or i-propylamino, n-, i-, s- or t-butylamino, diethylamino, diethylamino, methoxycarbonyl, ethoxycarbonyl, n- or i-propoxycarbonyl, dimethoxyphosphoryl, diethoxyphosphoryl or dipropoxyphosphoryl, diisopropoxyphosphoryl, each optionally substituted by fluorine, chlorine, methoxy or ethoxy, for propenyl, butenyl, propenyloxy, butenyloxy, propenylamino, butenylamino, propylidenamino, butylidenamino, propenyloxycarbonyl, butenyloxycarbonyl, propinyl, butinyl, propinyloxy, butinyloxy, propinylamino, butinylamino, propinyloxycarbonyl or butinyloxycarbonyl, each optionally substituted by fluorine or chlorine, for cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, cyclopropyloxy, cyclobutyloxy, cyclopentyloxy, cyclohexyloxy, cyclopropylmethyl, cyclobutylmethyl, cyclopentylmethyl, cyclohexylmethyl, cyclopropylmethoxy, cyclobutylmethoxy, cyclopentylmethoxy, cyclohexylmethoxy, cyclopentylidenamino, cyclohexylidenamino, cyclopentyloxycarbonyl, cyclohexyloxycarbonyl, cyclopentylmethoxycarbonyl or cyclohexylmethoxycarbonyl, each optionally substituted by fluorine, chlorine, cyano, carboxy, methyl, ethyl, n- or i-propyl, methoxycarbonyl or ethoxycarbonyl, or for phenyl, phenyloxy, benzyl, phenylethyl, benzyloxy, phenyloxycarbonyl, benzyloxycarbonyl, (each optionally completely or partially hydrated) pyrrolyl, pyrazolyl, imidazolyl, triazolyl, furyl, thienyl, oxazolyl, isoxazolyl, thiazolyl, isothiazolyl, oxadiazolyl, thiadiazolyl, pyrimidinyl, triazinyl, pyrazolylmethyl, furylmethyl, thienylmethyl, oxazolylmethyl, isoxazole methyl, thiazole methyl, pyridinylmethyl, pyrimidinylmethyl, pyrazolylmethyl, furylmethoxy or pyridylmethoxy, each optionally substituted by nitro, cyano, carboxy, fluorine, chlorine, bromine, methyl, ethyl, n- or i-propyl, trifluoromethyl, methoxy, ethoxy, n- or i-propoxy, difluoromethoxy, trifluoromethoxy, methoxycarbonyl and/or ethoxycarbonyl,

R⁶ stands for hydrogen, fluorine or chlorine,

R⁷ stands for hydrogen, hydroxy, for methyl, ethyl, n- or i-propyl, n-, i-, s- or t-butyl, each optionally substituted by cyano, fluorine, chlorine, methoxy, ethoxy, acetyl, propionyl, methoxycarbonyl or ethoxycarbonyl, for propenyl, butenyl, propinyl or butinyl, each optionally substituted by fluorine, chlorine or bromine, for cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, cyclopropylmethyl, cyclobutylmethyl, cyclopentylmethyl or cyclohexylmethyl, each optionally substituted by fluorine, chlorine, bromine, methyl or ethyl, for methoxy, ethoxy, n- or i-propoxy, n-, i- or s-butoxy, propenyloxy or butenyloxy, each optionally substituted by fluorine and/or chlorine, or for benzyl or benzyloxy, each optionally substituted by cyano, fluorine, chlorine, bromine, methyl, ethyl, trifluoromethyl, methoxy, ethoxy, difluoromethoxy or trifluoromethoxy, and

G stands for one of the following groupings,

-O-CO-, -S-CO-, -O-C(R⁸,R⁹)-CO-, -C(R⁸,R⁹)-O-CO-, -C(R⁸,R⁹)-C(R⁸,R⁹)-, -C(R⁸)=C(R⁸)-, -C(R⁸,R⁹)-CO-, -N(R¹⁰)-C(R⁸,R⁹)-CO-, -C(R⁸)=N-, -O-CO-C(R⁸,R⁹)-

with

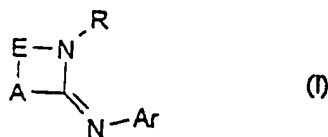


44

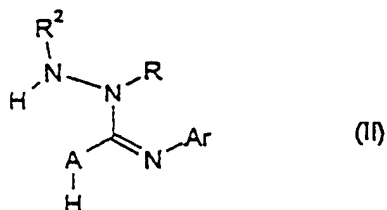
45

R^8 and R^9 being the same or different and individually standing for hydrogen, methyl, ethyl, n- or i-propyl, or together standing for ethane-1,2-diyl, and R^{10} standing for hydrogen, methyl, ethyl, n- or i-propyl.

4 Method of producing substituted arylimino heterocycles of general formula (I)



in which A, E, R and Ar have the meanings given in Claim 1, characterized in that arylimino compounds of general formula (II)



in which A, R and Ar have the meanings given above -- and/or pertaining tautomeric compounds -- are cyclized with reactive carbonic acids of general formula (III)



in which

Q has the meaning given above and

X stands for halogen, alkoxy, aryloxy or aralkoxy,

optionally in the presence of a reaction adjuvant and optionally in the presence of a diluent

and, if the R^2 stands for hydrogen, the compounds of formulas (IA) and/or (IB) thus obtained are optionally reacted with alkylation agents of general formula (IV)



in which

R^2 has the meaning given above, except for hydrogen, and



4.

5.

X¹ stands for halogen or the grouping -O-SO₂-O-R², optionally in the presence of a reaction adjuvant and optionally in the presence of a diluent.

5. Method of combatting weeds, characterized in that substituted arylimino heterocycles of general formula (I) according to Claims 1 through 4, are allowed to act on plants and/or their habitat.

6. Use of substituted arylimino heterocycles of general formula (I) according to Claims 1 through 4 to combat weeds.

7. Method of producing herbicides, characterized in that substituted arylimino heterocycles of general formula (I) according to Claims 1 through 4 are mixed with fillers and/or surfactants.

8. Herbicides characterized by a content of at least one substituted arylimino heterocycle of general formula (I) according to Claims 1 through 4.

